

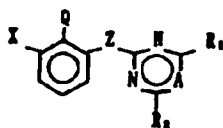


## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<b>(51) 国際特許分類6</b> <b>C07D 413/12, 413/14, 417/14, A61K 43/76, 43/84, 47/10, 47/30</b>	<b>A1</b>	<b>(11) 国際公開番号</b> <b>WO96/33994</b>  <b>(43) 国際公開日</b> <b>1996年10月31日(31.10.96)</b>
<b>(21) 国際出願番号</b> PCT/JP96/01155 <b>(22) 国際出願日</b> 1996年4月26日(26.04.96)  <b>(30) 優先権データ</b> 特願平7/129334 1995年4月28日(28.04.95) JP  <b>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)</b> 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.)(JP/JP) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP) <b>(72) 発明者: および</b> <b>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)</b> 植田昭嘉(UEDA, Akiyoshi)(JP/JP) 宮澤靖之(MIYAZAWA, Yasuyuki)(JP/JP) 佐藤大祐(SATO, Daisuke)(JP/JP) 原 良彦(HARA, Yoshihiko)(JP/JP) 古口正巳(KOGUCHI, Masami)(JP/JP) 松本勲子(MATSUMOTO, Isoko)(JP/JP) 川名 貴(KAWANA, Takashi)(JP/JP) 〒250-02 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP)		<b>(74) 代理人</b> 弁理士 東海裕作(TOKAI, Yusaku) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)  <b>(81) 指定国</b> BR, CN, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE)  <b>添付公開書類</b> 国際調査報告書 請求の範囲の補正の期限前であり、補正書受領の際には再公開される。

**(54) Title: AMINO-SUBSTITUTED DERIVATIVES, PROCESS FOR THE PREPARATION THEREOF, AND HERBICIDE**

**(54) 発明の名称** アミノ置換誘導体、製造方法及び除草剤



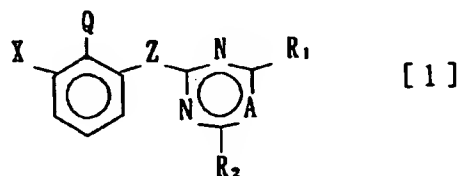
(I)

**(57) Abstract**

Novel amino-substituted derivatives represented by general formula (I) exhibiting a herbicidal activity higher than those of known analogues thereof, a process for the preparation thereof, and a herbicide comprising the same as the active principle. In said formula, A is N or CR<sub>3</sub>; Z is O or S; Q is a five- or six-membered heterocycle; R<sub>1</sub> and R<sub>2</sub> are each independently H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy or the like; R<sub>3</sub> is H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, halogeno or the like; and X is NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub> (wherein R<sub>4</sub> and R<sub>5</sub> are each independently H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl or the like, or R<sub>4</sub> and R<sub>5</sub> may together form a ring).

# (57) 要約

本発明は、類似の公知化合物に比し優れた除草活性を有する、一般式〔1〕で表される新規なアミノ置換誘導体、製造方法及びそれを有効成分とする除草剤である。



〔式中、AはN又はCR<sub>3</sub>を表し、ZはO又はSを表し、Qは5～6員のヘテロ環を表し、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>は各々独立して水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基等を表し、R<sub>3</sub>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、ハロゲン原子等を表し、Xは、式 NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>（式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は各々独立して、水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシC<sub>1-6</sub>アルキル基等を表すか、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が一緒になって環を形成してもよい）を表す。〕

## 情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を特定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LC	セントルシア	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RO	ルーマニア
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
AZ	アゼルバイジャン	FI	フィンランド	LS	レソト	SD	スーダン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FR	フランス	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	GB	ガボン	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GR	ギリシャ	LV	ラトヴィア	SK	スロバキア
BF	ブルキナ・ファソ	GU	グニヤ	MC	モナコ	SL	スロウェニア
BG	ブルガリア	HN	ハイチ	MD	モルドヴァ共和国	SN	セネガル
BI	ベナン	IE	アイルランド	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BJ	ベナン	IL	イスラエル	MK	マケドニア共和国	TD	チャド
BR	ブラジル	IT	イタリア	ML	マリ	TC	タークス・カコス
BS	バハマ	JP	日本	MN	モンゴル	TG	トーゴ
CA	カナダ	KE	ケニア	MR	モリタニア	TM	トルクメニスタン
CC	中央アフリカ共和国	KG	キルギスタン	MW	マラウイ	TR	トルコ
CG	コンゴ	KP	朝鮮民主主義人民共和国	MX	メキシコ	TT	トリニダード・トバゴ
CH	スイス	KR	韓国	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CI	コート・ジボアール	KZ	カザフスタン	NL	オランダ	UG	ウガンダ
CM	カメルーン			NO	ノルウェー	UZ	ウズベキスタン
CN	中国			NZ	ニュージーランド	VN	ベトナム
CU	キューバ						
CZ	チェコ共和国						

## 明 細 書

## アミノ置換誘導体、製造方法及び除草剤

## 技術分野：

本発明は新規なアミノ置換誘導体、製造方法及び除草剤に関する。

## 背景技術：

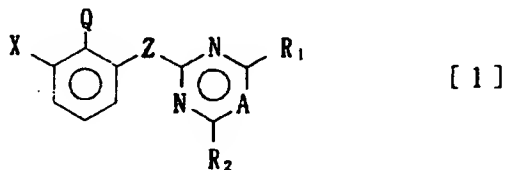
農園芸作物の栽培にあたり、多大の労力を必要としてきた雑草防除に多くの除草剤が使用されるようになってきた。しかし作物に薬害を生じたり、環境に残留したり、汚染したりすることから、より低い薬量で効果が確実でしかも安全に使用できる薬剤の開発が望まれている。

本発明化合物と関連した化合物を開示したものとして、WO 94/17059 にXがアミノ基であり、Qが5-オキサゾリル基である化合物の除草活性及びその製造法の記載がある。しかしながらその生物活性は実用的には不十分なものである。

本発明の目的は、工業的に有利に合成でき、より低い薬量で効果の確実な安全性の高い、作物との選択性の良い除草剤を提供することである。

## 発明の開示：

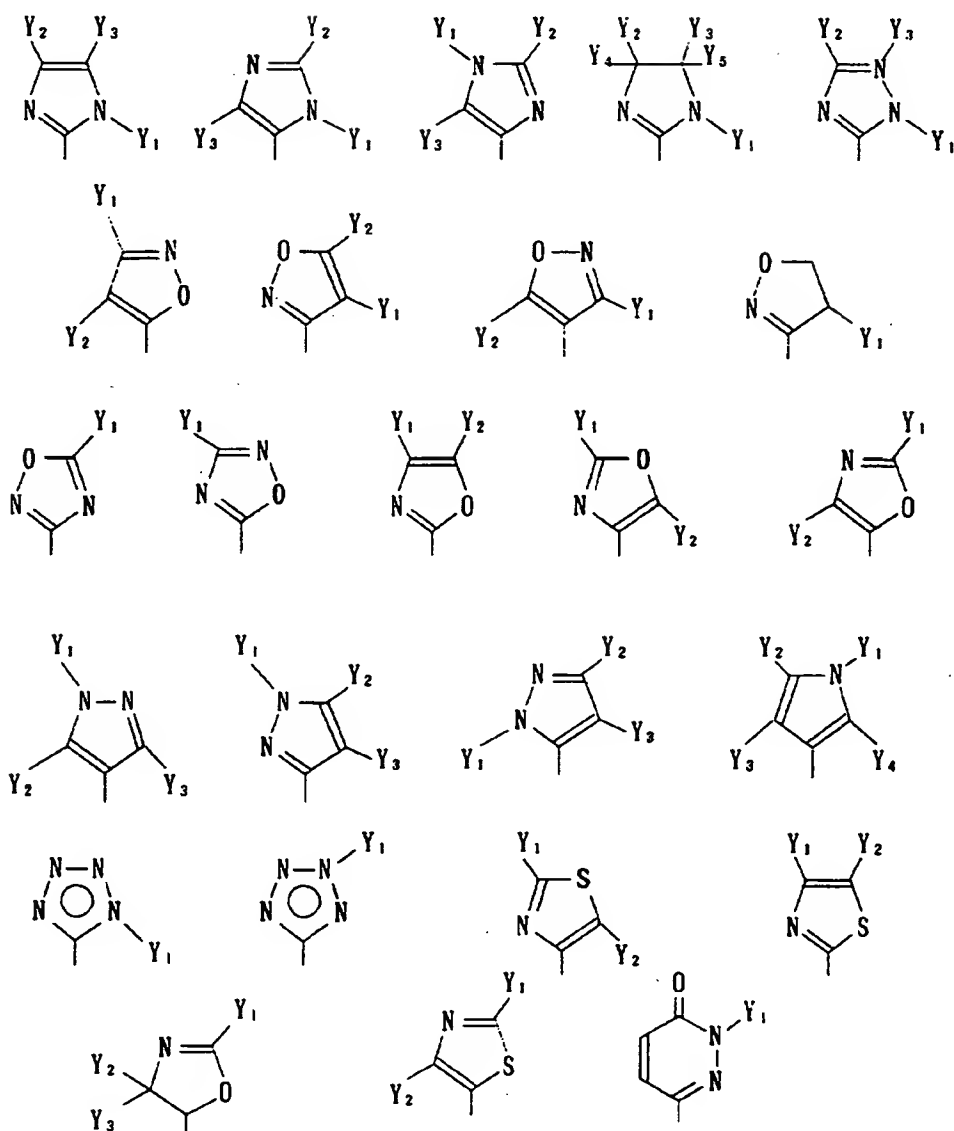
本発明は、一般式〔1〕で表わされるアミノ置換誘導体又はその塩、その製造方法及び該化合物を有効成分として含有することを特徴とする除草剤である。



〔式中、AはN又はCR<sub>3</sub>を表し、ZはO又はSを表し、Qは炭素原子でベンゼ

ン環と結合している、N、O、もしくはSを同一または相異なって1～4個含む置換基を有していてもよい5～6員のヘテロ環を表し、 $R_1$ 、 $R_2$ は各々独立して水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロ $C_{1-6}$ アルキル基、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子又はシアノ基を表し、 $R_3$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、ホルミル基、アシル基を表すか、又は $R_2$ と一緒に環を形成していても良く、 $X$ は、式 $NR_4R_5$ （式中、 $R_4$ 及び $R_5$ は各々独立して、水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ヒドロキシ $C_{2-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基又は置換されてもよいヘテロ環カルボニル基を表すか、 $R_4$ と $R_5$ が一緒に環を形成してもよい。但し、 $R_4$ と $R_5$ が共に $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、ではない。）を表す。）

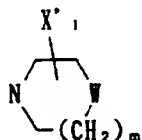
本発明において、 $Q$ で表されるヘテロ環としては下記式のものが例示される。



(式中、Y<sub>1-3</sub> は水素原子、C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>3-7</sub> シクロアルキル基、ハロC<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> アルコキシC<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> アルキルチオC<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニルC<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>2-6</sub> アルケニル基、C<sub>2-6</sub> アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C<sub>1-6</sub> アルキルアミノ基、アシルアミノ基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、ヒドロキシル基、カルボキシル基、C<sub>1-6</sub> アルコキシカルボニル基、C<sub>1-6</sub> アルコキシ基、置

換されても良いベンジルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、ハロ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$  アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$  アルキニルチオ基、アシルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、アミノオキシ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いフェニルチオ基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、置換されても良いヘテロ環オキシ基又はヘテロ環チオ基を表し、又、2つの  $Y_1 - Y_5$  で炭素環又はヘテロ環を形成してもよい。)

また、Xで表される基において  $R_4$  と  $R_5$  が一緒になって形成するヘテロ環としては下記式のヘテロ環が挙げられる。



(式中、WはO、S、SO、SO<sub>2</sub>、CR<sub>6</sub>及びNR<sub>7</sub>を表し、X'及びR<sub>6</sub>は水素原子、 $C_{1-12}$ アルキル基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ヒドロキシ  $C_{2-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$ アルキル基、水酸基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、ハロ  $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基、アシル基、アミノ基又はカルボキシル基を表し、 $R_7$ は水素原子、 $C_{1-12}$ アルキル基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル  $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ヒドロキシ  $C_{2-6}$ アルキル基、C

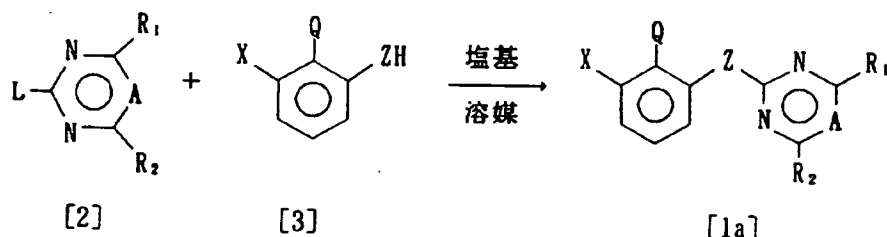
1-6 アルコキシカルボニル基、アミノ C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> アルコキシカルボニル C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、m は 0 または 1 ~ 3 の整数を表す。)

一般式〔1〕で表される化合物の塩としては、農園芸上許容される塩、例えば、塩酸塩、臭化水素塩等の無機酸塩類、酢酸塩、蔞酸塩、蟻酸塩等の有機酸塩類等、及びアルカリ金属、アルカリ土類金属、アンモニウム塩等が挙げられる。

発明を実施するための最良の形態：

本発明の化合物は、以下の方法によって製造することができる。

(製造法-1) 反応式 1



(式中、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、X及びZは前記と同じ意味を表し、Lはハロゲン原子又はアルキルスルホニル基を表す。)

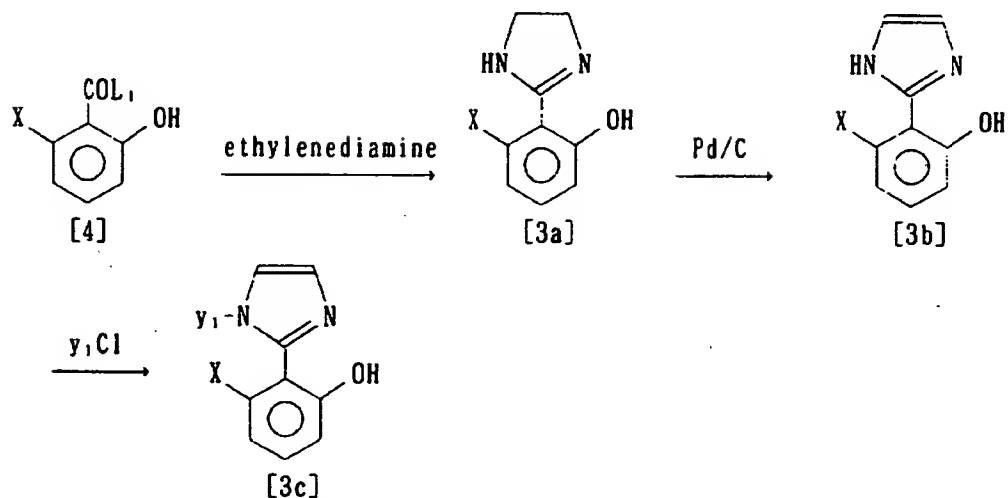
一般式〔2〕で表される化合物と一般式〔3〕で表される化合物とを有機溶媒中適当な塩基の存在下カップリングさせる。反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0 ~ 90℃、場合によっては120℃で攪拌される。

上記反応における原料化合物〔3〕のo-ヘテロ環置換フェノール誘導体は以

下に述べるような方法により製造することができる。尚、特に指定をしていない場合、以下の反応において用いられる溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等のニトリル類、水等である。又、用いられる塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム等の水素化金属類、ブチルリチウム等のアルキル金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等である。又、用いられる酸は塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類、蟻酸、酢酸等の有機酸類、塩化アルミニウム、ボロントリフロリドジエチルエーテル等のルイス酸類である。反応は、 $-90^{\circ}\text{C}$ から用いられる溶媒の沸点の温度範囲で円滑に進行する。

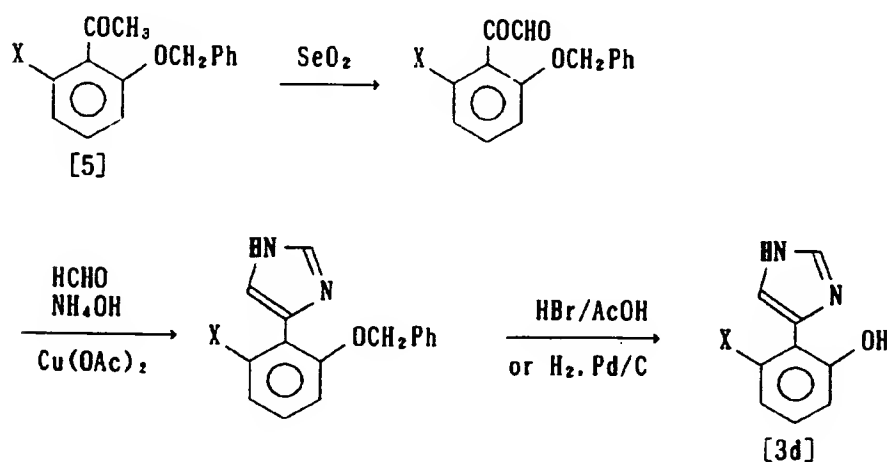
(1) Qがイミダゾリン-2-イル及びイミダゾール-2-イルの化合物は、J. Amer. Chem. Soc. 96巻, 2463ページ(1974年)に記載の方法を応用して製造することができる。





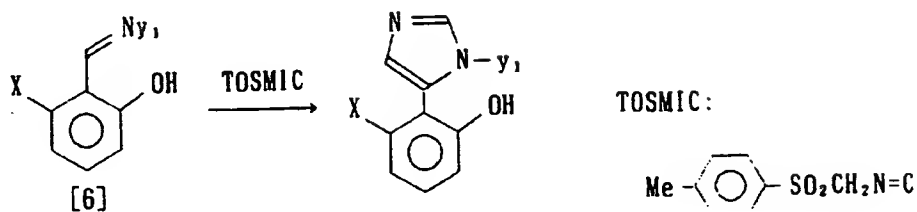
(式中、Xは前記と同じ意味を表し、L<sub>1</sub>はアルコキシ基、塩素原子又は1-イミダゾール基を表し、y<sub>1</sub>はアルキル基、ベンジル基又はp-トルエンスルホン基を表す。)

(2) Qがイミダゾール-4-イルの化合物は、J. Amer. Chem. Soc. 82巻、3386ページ(1960年)に記載の方法を応用して製造することができる。



(式中、Xは前記と同じ意味を表す。)

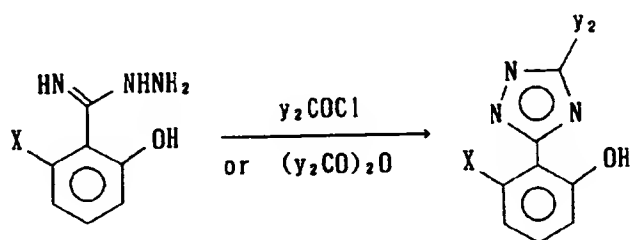
又、J. Org. Chem. 42巻, 1153ページ(1977年)に記載の方法で製造することもできる。



(式中、X及びy<sub>1</sub>は前記と同じ意味を表す。)

(3) Qが1, 2, 4-トリアゾール-3-イルの化合物

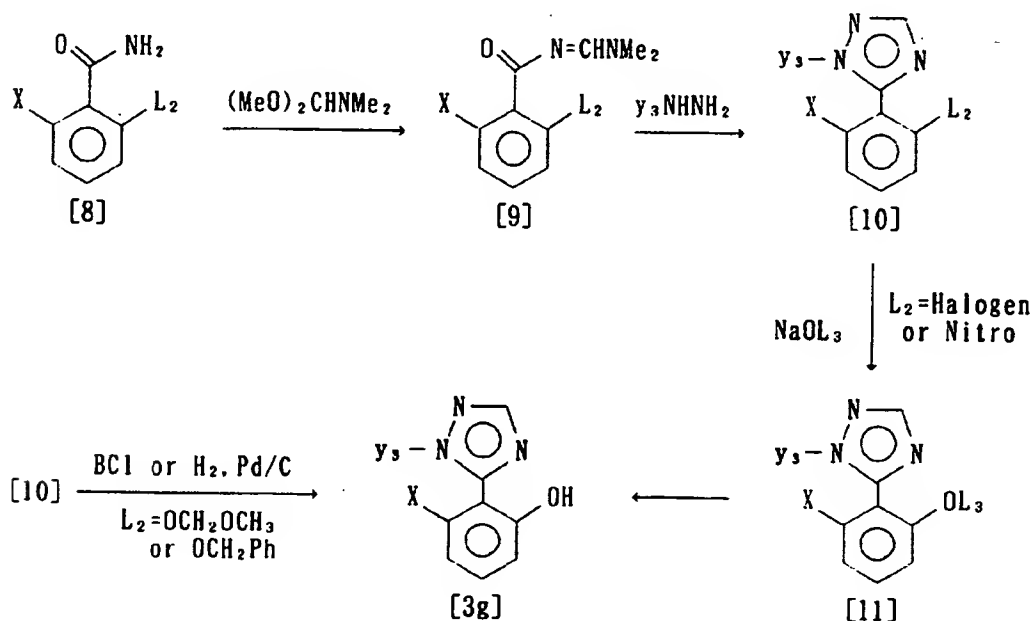
化合物[7]を酸クロライドもしくは、酸無水物とDMF中、0~120℃で反応させることにより製造することができる。



(式中、Xは前記と同じ意味を表し、y<sub>2</sub>はアルキル基、アリール基又はハロアルキル基を表す。)

2位置換-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル誘導体は、J. Org. Chem. 44巻、4160ページ(1979年)に記載の方法に従い、アミド[8]とジメチルホルムアミドジメチルアセタールを反応させて、N-[(ジメチルアミノ)メチレン]アミド[9]を合成する。[9]にヒドラジン類を反応させて、トリアゾール[10]へと誘導する。L<sub>2</sub>がメトキシメトキシ、ベンジルオキシ基の場合は、[10]を酸で処理するか、パラジウム炭素等を触媒にした加水素化分解反応によって得られる。

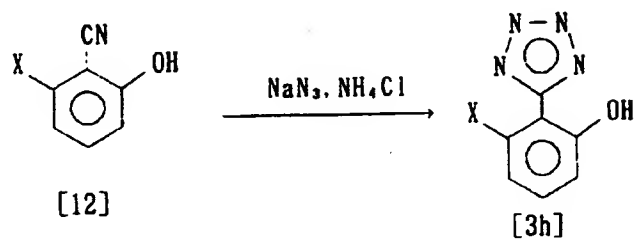
$L_2$  がハロゲン、ニトロの場合には、[10] にナトリウムアルコラートを反応させて、化合物 [11] を合成する。[11] から [3g] への変換は、"Protective Groups in Organic Synthesis" T. W. Greene 編集、JOHN WILEY & SONS, N. Y. 発行、第3章、87ページに記載の方法から、適切な反応を選択して行われる。例えば、1)  $LiCl$  等の塩をDMFやDMSO等の溶媒中で、加熱する方法、2)  $HBr$  / 酢酸中加熱する方法、3) ピリジン塩酸塩中加熱する方法、4) 金属触媒を用いた加水素化分解による方法、5) ボロントリハライド等のルイス酸による脱アルキル化等が挙げられる。



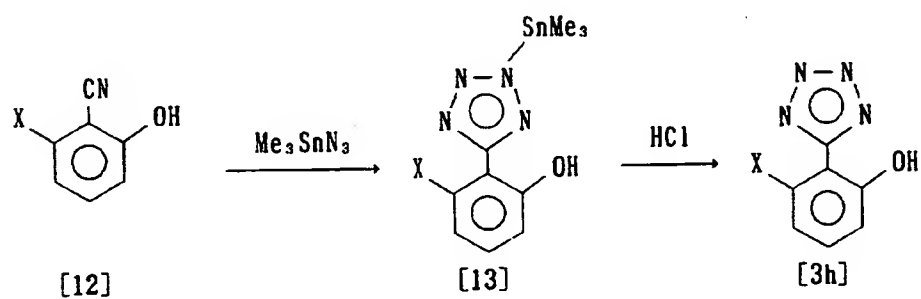
(式中、Xは前記と同じ意味を表し、 $L_2$  はメトキシメトキシ基、ベンジルオキシ基、ニトロ基又はハロゲン原子を表し、 $L_3$  はアルキル基又はベンジル基を表し、 $y_3$  はアルキル基、ベンジル基又はフェニル基を表す。)

(4) Qがテトラゾール-5-イルの誘導体は、J. Amer. Chem. Soc. 80巻、3908ページ(1958年)の方法を応用して、ニトリル [12]

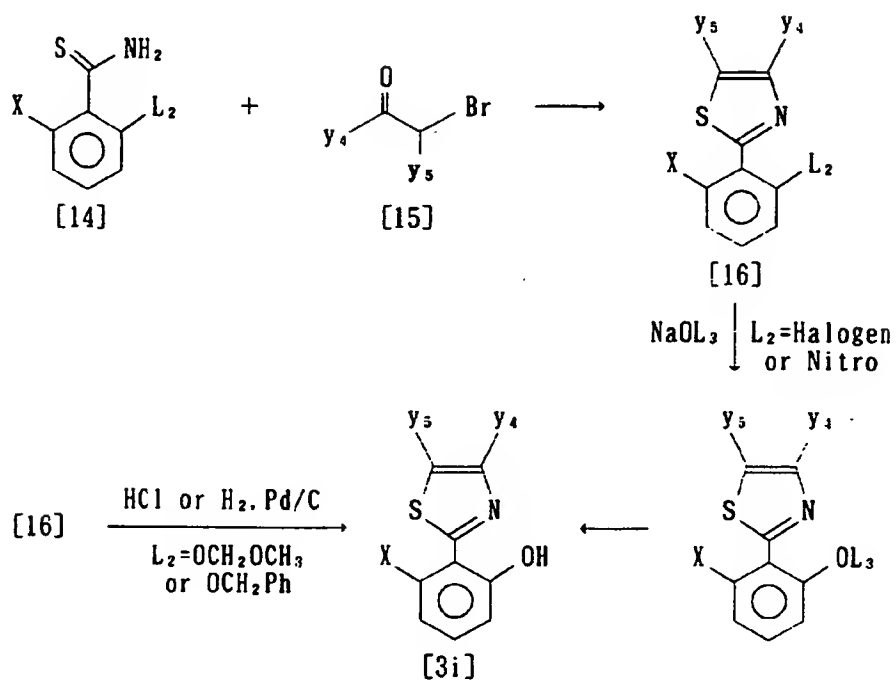
にアジ化ナトリウムと塩化アンモニウムをDMF中80～140℃で1～48時間反応させることにより製造することができる。



また、J. Org. Chem. 56巻、2395ページ（1991年）に記載される方法により、スズアジドと[12]を反応させても製造することができる。

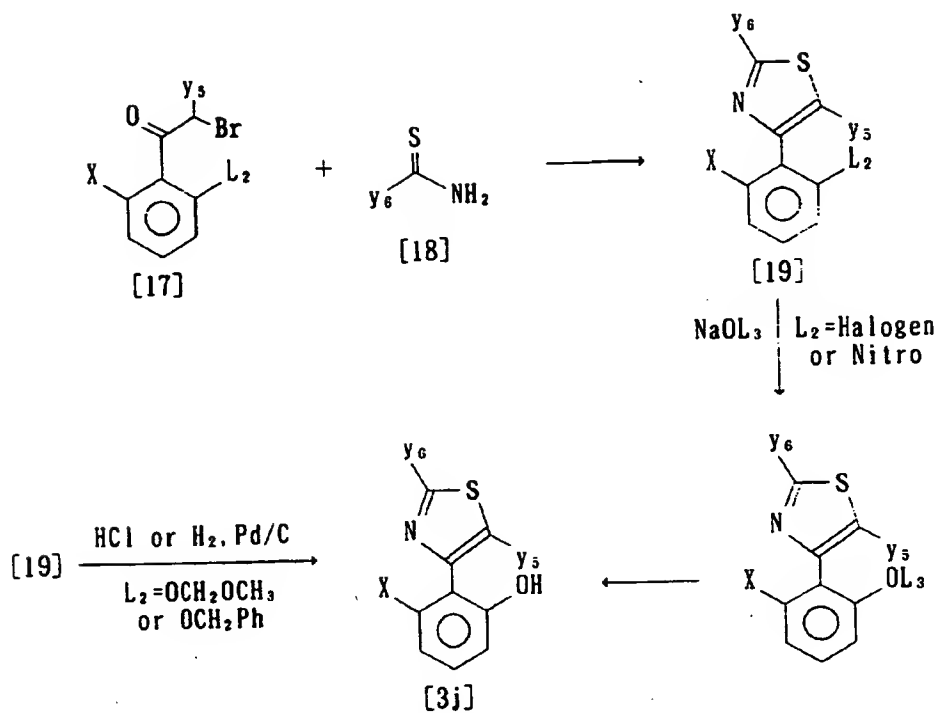


(5) Qがチアゾール-2-イルの誘導体は下記反応式のようにして合成される。



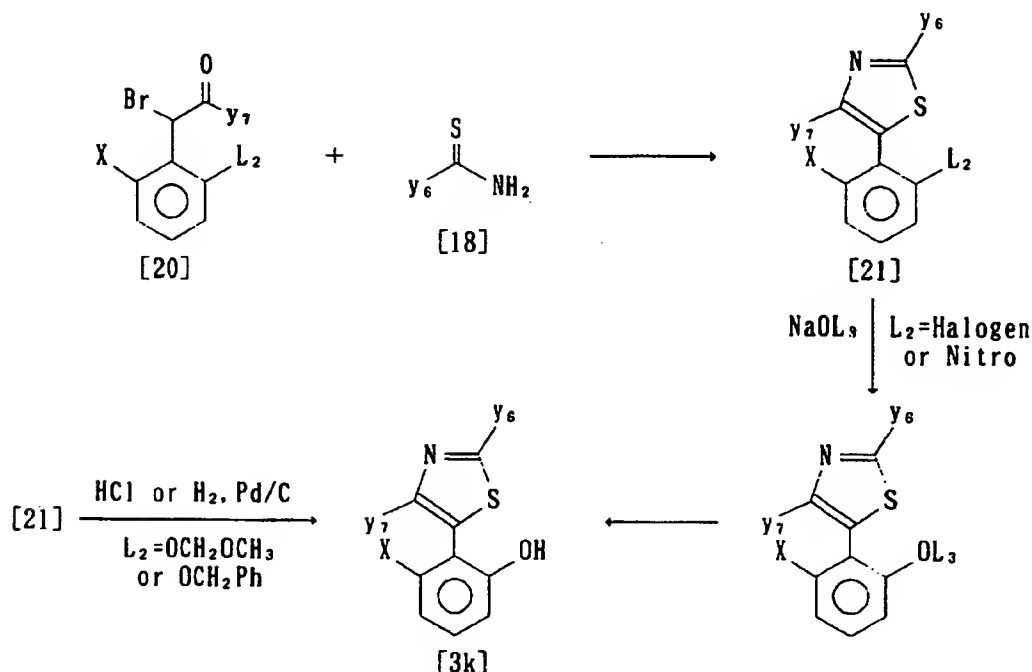
(式中、X、L<sub>2</sub> 及び L<sub>3</sub> は前記と同じ意味を表し、y<sub>4</sub> はアルキル基、アリール基又はハロアルキルを表し、y<sub>5</sub> は水素原子、アルキル基又はアルコキシカルボニル基を表し、R<sub>10</sub>はアルキル基を表す。)

(6) Qがチアゾール-4-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



(式中、X、L<sub>2</sub>、L<sub>3</sub>及びy<sub>5</sub>は前記と同じ意味を表し、y<sub>6</sub>はアルキル基、アリール基、アミノ基、アルキルアミノ基又はアリールアミノ基を表す。)

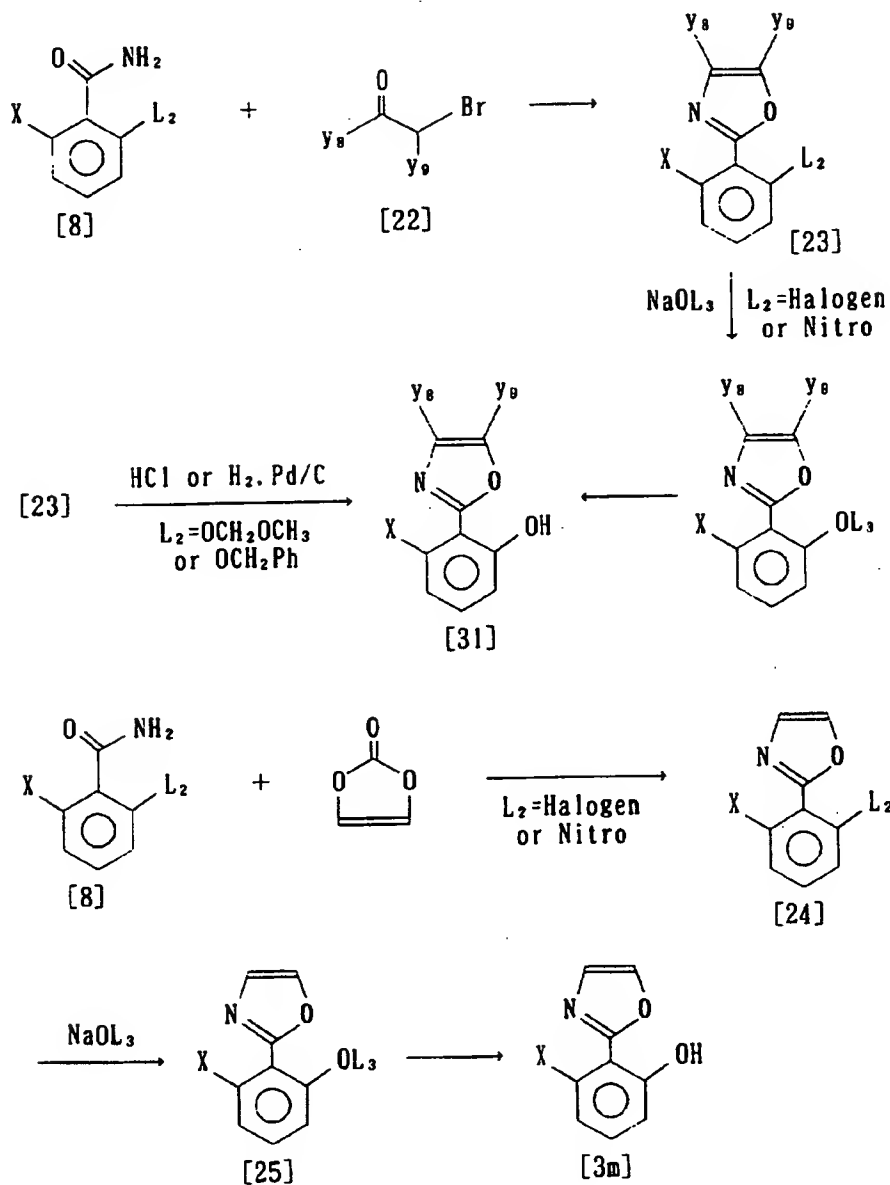
(7) Qがチアゾール-5-イルの誘導体も、前述と同様の方法によって製造することが出来る。



(式中、X、L<sub>2</sub>、L<sub>3</sub>及びy<sub>6</sub>は前記と同じ意味を表し、y<sub>7</sub>はH又はアルキル基を表す。)

尚、これらのチアゾール誘導体の合成法は、Chem. Heterocyclic Compounds、34巻、パート1～3(1978～1979年)、あるいは、"Heterocyclic Compounds" R. C. Elderfield編集、WILEY、N. Y. 発行、5巻、484～722ページ(1957年)に記載されている。

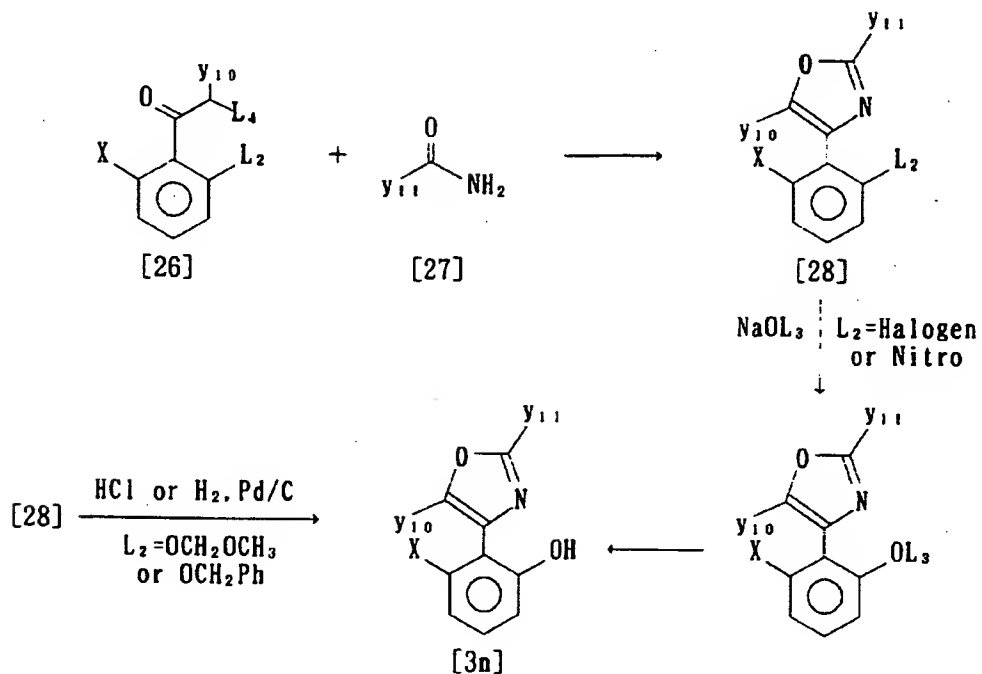
(8) Qがオキサゾール-2-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



(式中、X、 $L_2$  及び  $L_3$  は前記と同じ意味を表し、 $Y_1$  は水素原子、アルキル基、フェニル基又はハロアルキル基を表し、 $Y_2$  は水素原子、アルキル基又はフェニル基を表す。)

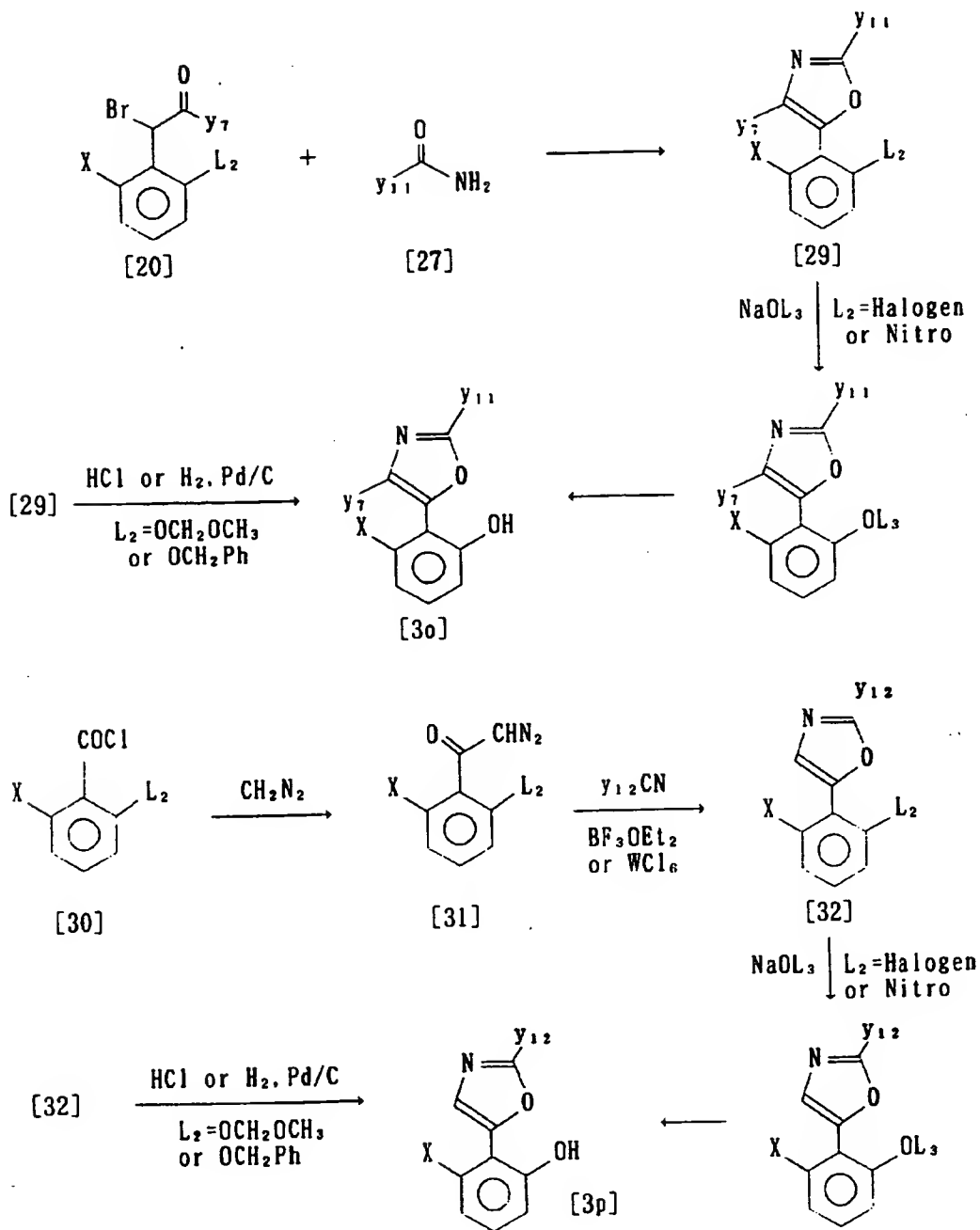


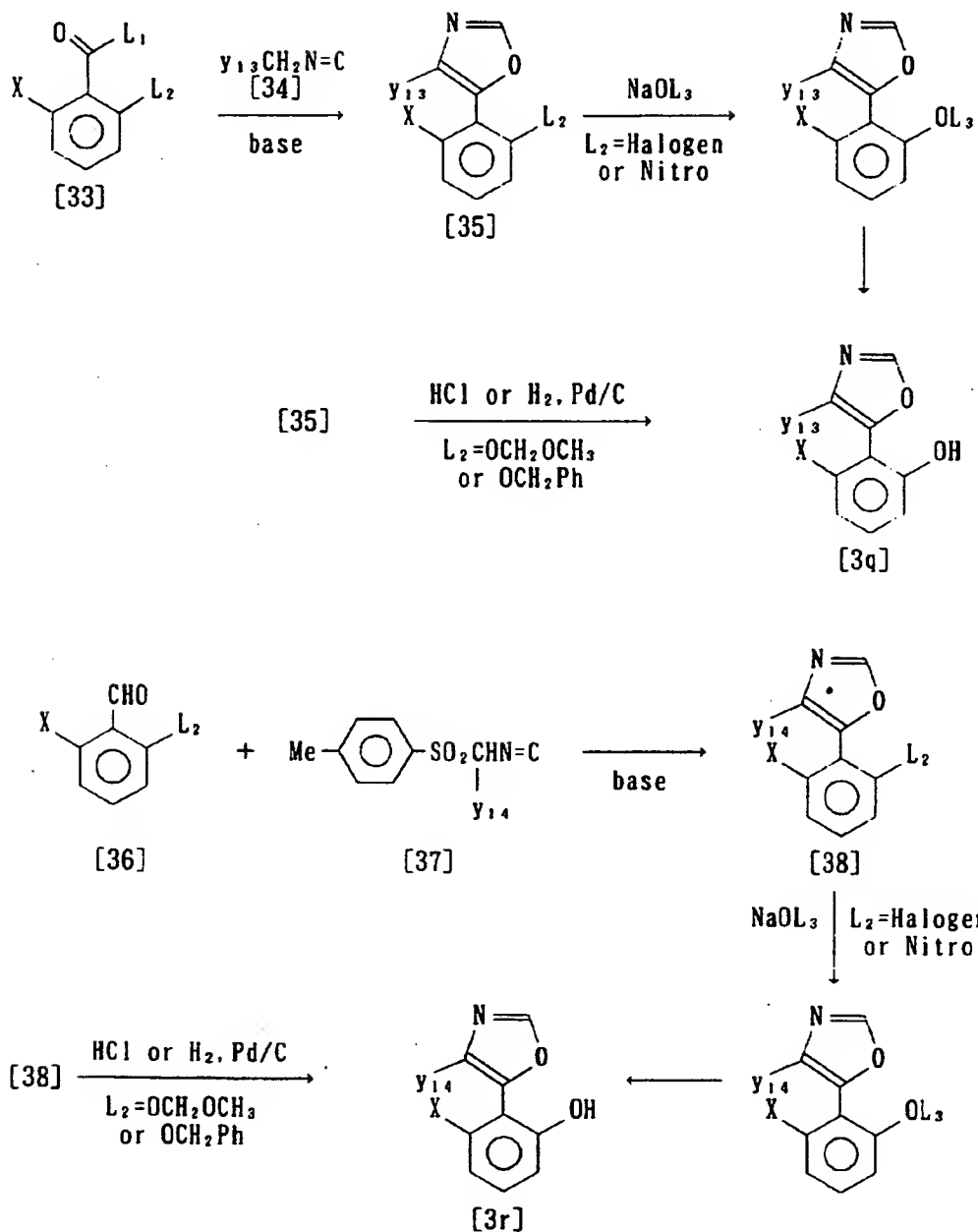
(9) Qがオキサゾール-4-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



(式中、X、L<sub>2</sub> 及び L<sub>3</sub> は前記と同じ意味を表し、L<sub>4</sub> はハロゲンを表し、y<sub>10</sub> は水素、メチル、エチル基又はアルキルカルボニル基を表し、y<sub>11</sub> は水素原子、アルキル基又はフェニル基を表す。)

(10) Qがオキサゾール-5-イルの誘導体は下記反応式のようにして合成される。

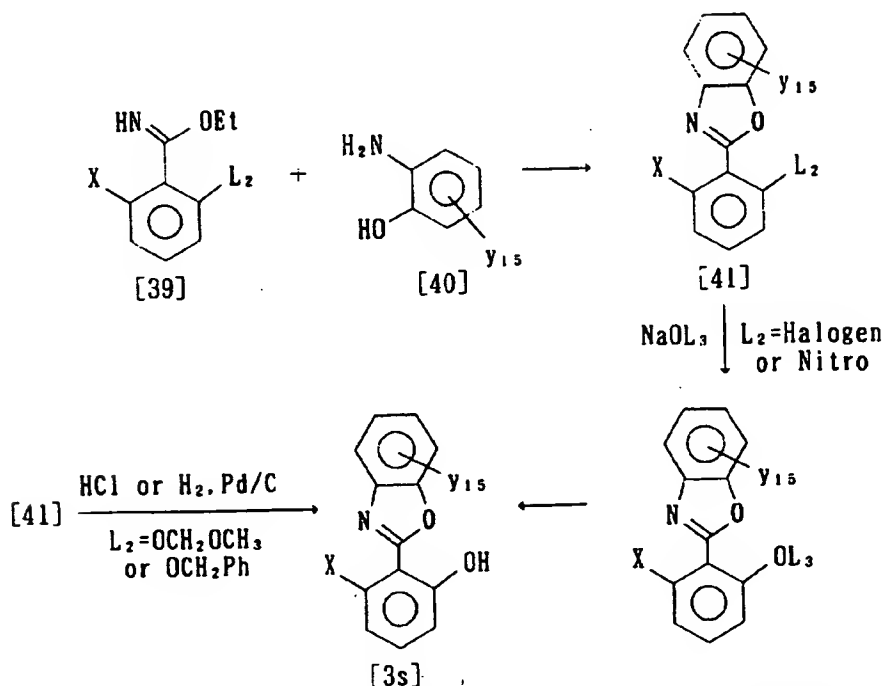




(式中、X、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>、L<sub>3</sub>、y<sub>7</sub>及びy<sub>11</sub>は前記と同じ意味を表し、y<sub>12</sub>はアルキル基又はフェニル基を表し、y<sub>13</sub>は水素原子、アルキル基、ベンジル基、フェ

ニル基、アルコキシカルボニル基又はトシル基を表し、 $y_{15}$ は水素原子、アルキル基又はベンジル基を表す。)

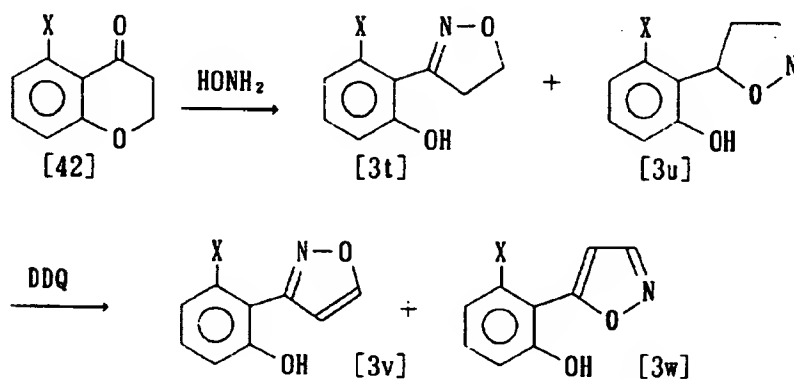
(11) Qが縮合オキサゾール-2-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



(式中、X、 $L_2$  及び  $L_3$  は前記と同じ意味を表し、 $y_{15}$ は水素原子、アルキル基又はハロゲン原子を表す。)

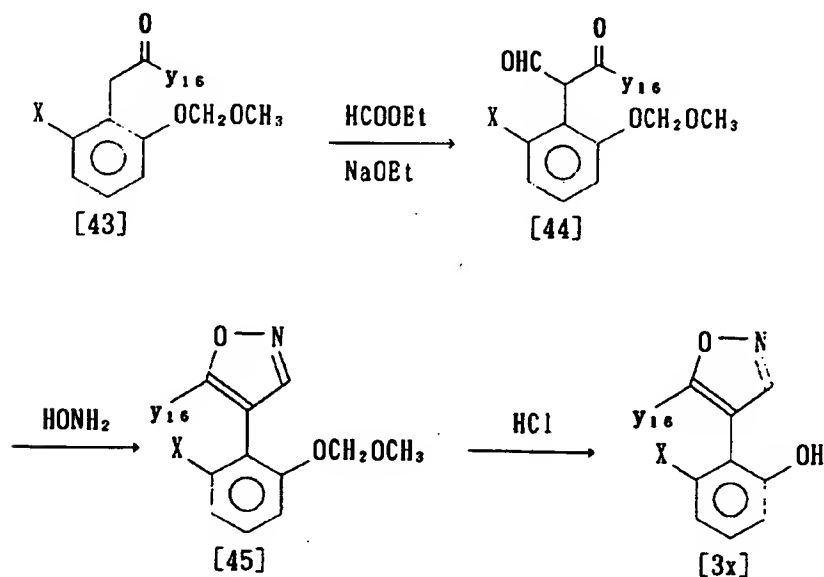
尚、オキサゾール誘導体の製造法に関する著書としては多数あるが、"Heterocyclic Compounds" 45巻、I. J. Turchi編集、JOHN WILEY, N. Y. 発行(1986年)及び、"Heterocyclic Compounds" R. C. Elderfield編集、WILEY, N. Y. 発行、5巻、298~451ページ(1957年)に記載の方法、文献を参考にすることができる。

(12) イソオキサゾリン-3-イル体、イソオキサゾリン-5-イル体、イソオキサゾール-3-イル体及びイソオキサゾール-5-イル体は 下記反応式のようにして合成される。



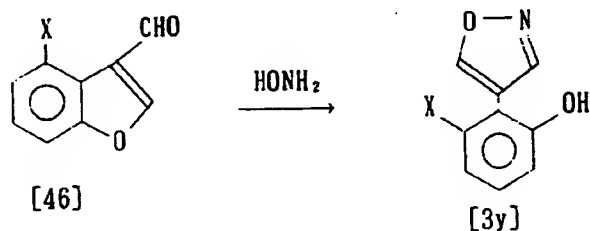
イソオキサゾリン-3-イル体とイソオキサゾリン-5-イル体の混合物はクロマトグラフィーや再結晶により、容易に分離できる。

(13) Qがイソオキサゾール-4-イルの誘導体は、薬学雑誌、79巻、623ページ(1959年)記載の方法を参考にして合成される。

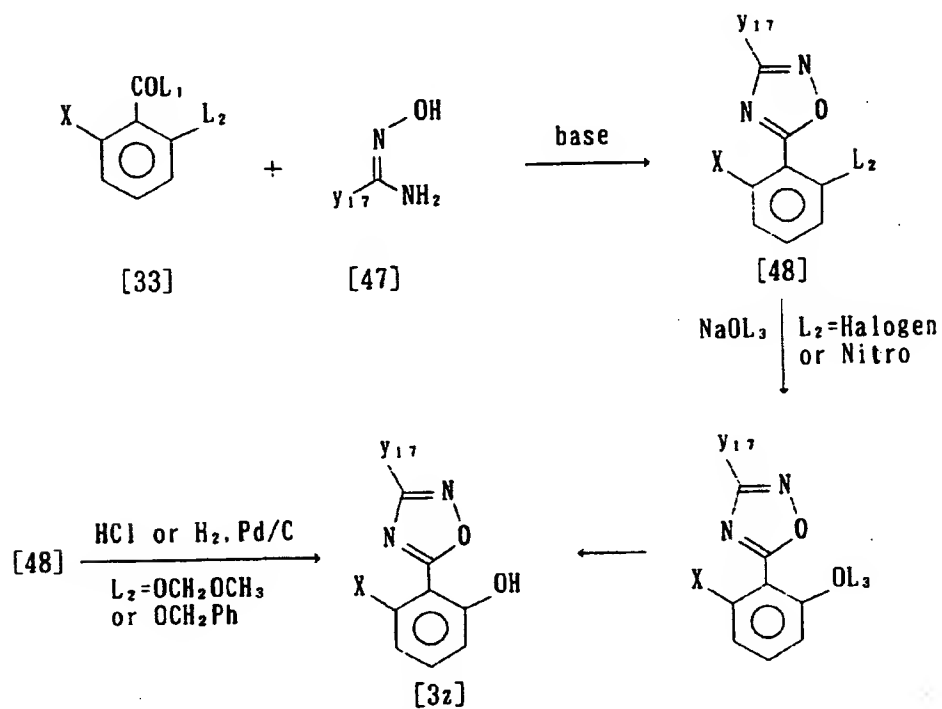


(式中、 $y_{16}$ は水素原子、アルキル基又はフェニル基を表す。)

あるいは、ベンゾフランとヒドロキシルアミンとをアルコール中、25～80℃で0.5～8時間反応させることにより得ることが出来る。



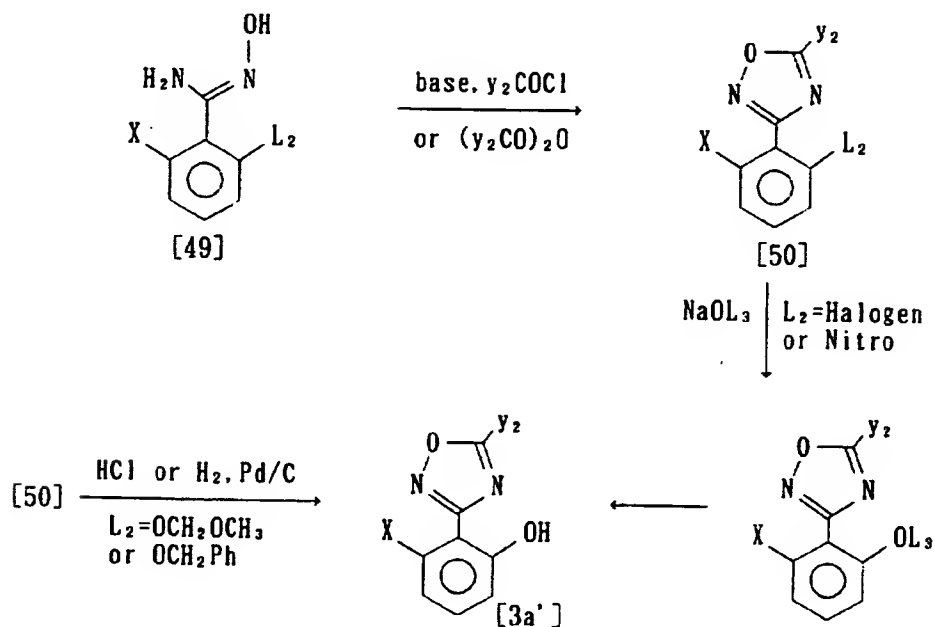
(14) Qが1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



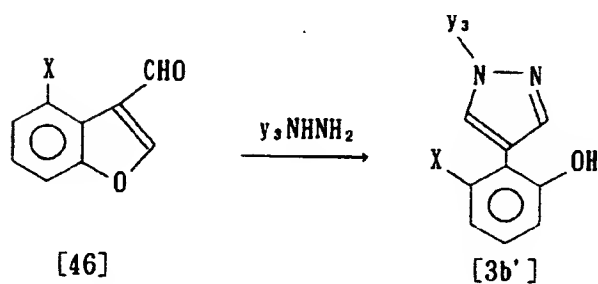
(式中、 $y_{17}$ は水素原子、アルキル基、ベンジル基、アリール基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基又はアルキルチオアルキル基を表し、X、 $L_1$ 、 $L_2$ 又は

L<sub>3</sub> は前記と同じ意味を表す。)

(15) Qが1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。

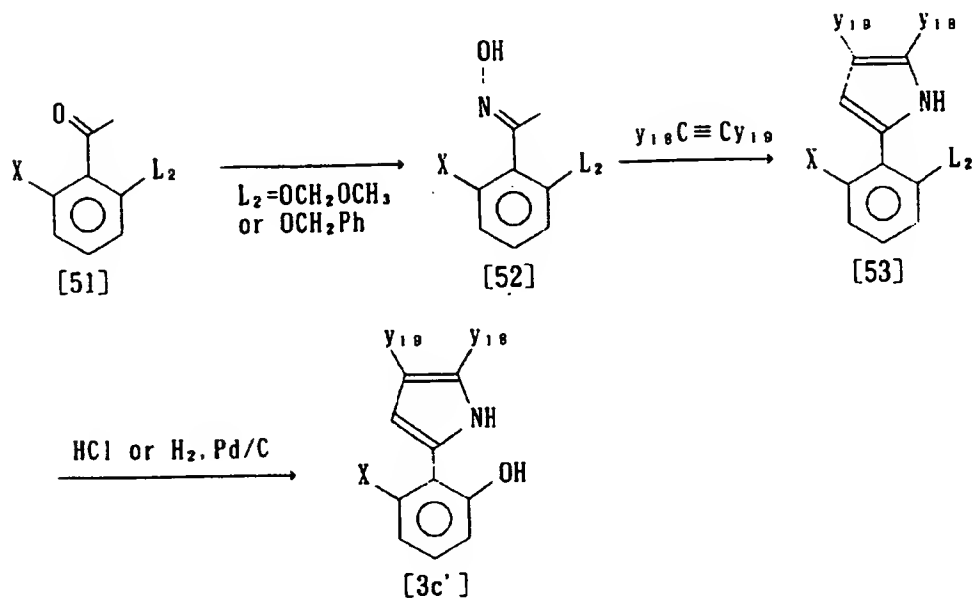


(16) Qがピラゾール-4-イルの誘導体は下記反応式のようにして合成される。



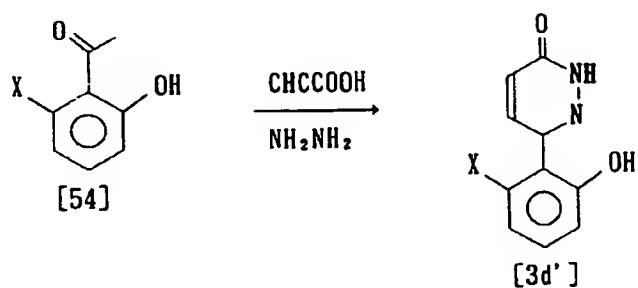
(式中、y<sub>3</sub> は前記と同じ意味を表す。)

(17) Qがピロール-2-イルの誘導体は、下記反応式のようにして合成される。



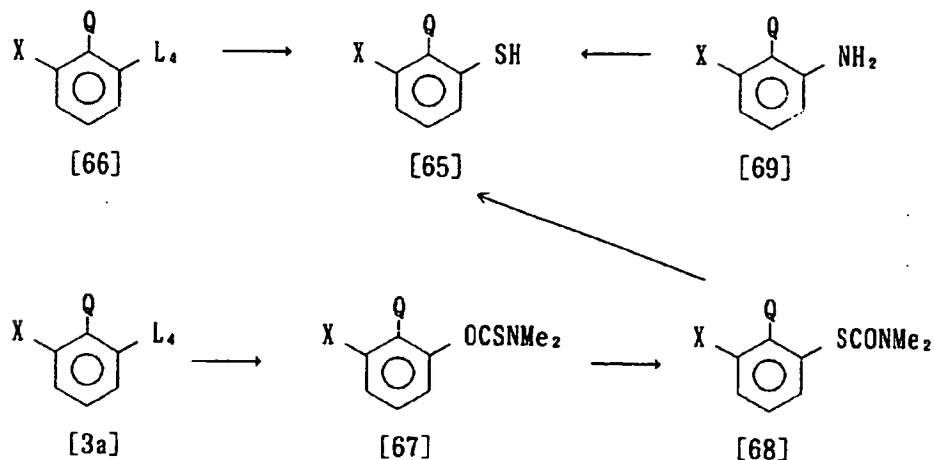
(式中、y<sub>18</sub>及びy<sub>19</sub>はシアノ基、アルコキシカルボニル基又はフェニル基を表し、X及びL<sub>2</sub>は前記と同じ意味を表す。)

(18) Qが3-ピリダジノン-6-イルの誘導体は下記反応式のようにして合成される。





また、反応式 1 における化合物 [3] において、Z が S であるチオフェノール誘導体は、下記反応式に従って合成される。



(式中、X 及び Q は前記と同じ意味を表し、L<sub>4</sub> はハロゲン原子、好ましくはフッ素を表す)

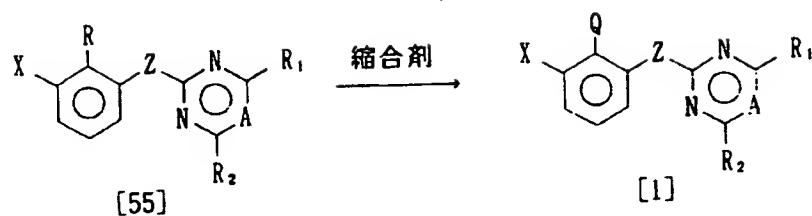
上述のフェノール誘導体の合成法に準じた方法で製造する事の出来る、一般式 [66] の化合物に硫化ナトリウムやチオウレア等を反応させて、化合物 [65] を製造することが出来る。この反応の参考文献としては、Chemistry Letters、1307 ページ (1985 年) が挙げられる。

あるいは、[65] は、前述の化合物 [3a] を [67] に誘導した後、J. Org. Chem. 31 巻、3980 ページ (1966 年) に記載された、ニューマン転位反応により [68] として、これを加水分解する事によっても製造することが出来る。

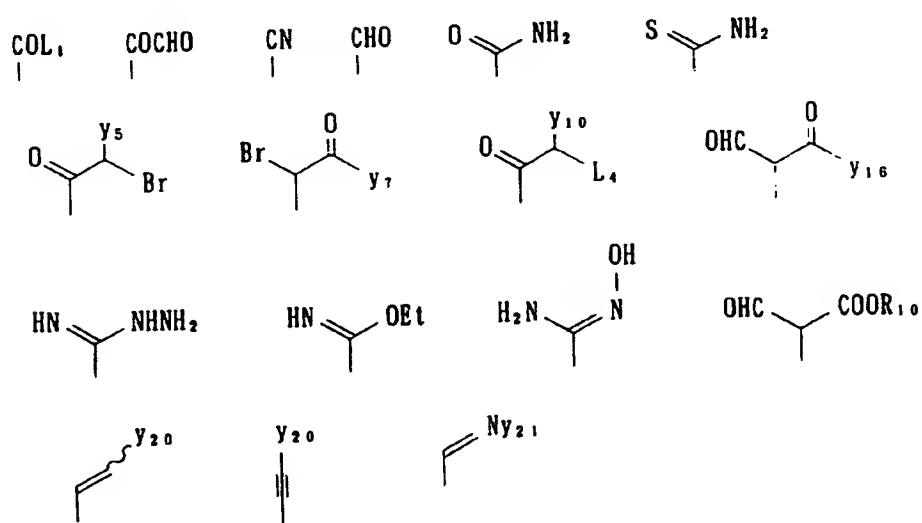
又、アニリン誘導体 [69] を Organic Syntheses Collect.、3 巻、809 ページに記載の方法を応用しても、[65] を製造することが出来る。(式中、L<sub>4</sub> はハロゲンを表す。)

#### (製造法-2)

又、次の方法によっても本発明化合物を製造することが出来る。

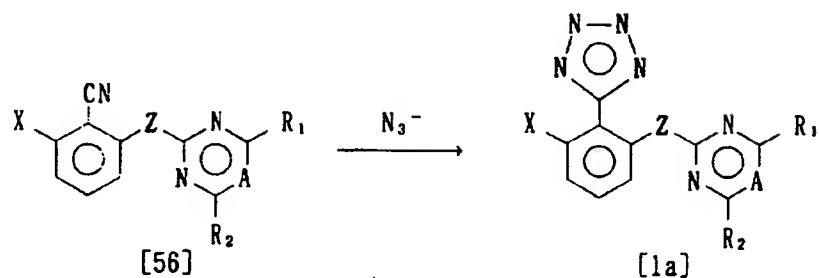


(式中、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、X、Z及びQは前記と同じ意味を表し、Rは下記で表されるいずれかの基を表す。)



即ち、一般式 [55] で示される化合物と、上記 [3] の製造法で示された、適当な縮合剤を反応させることにより [1] を製造する方法である。

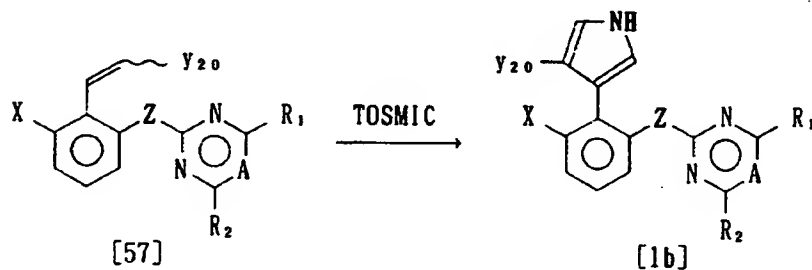
## a) テトラゾール [1a] の製造法

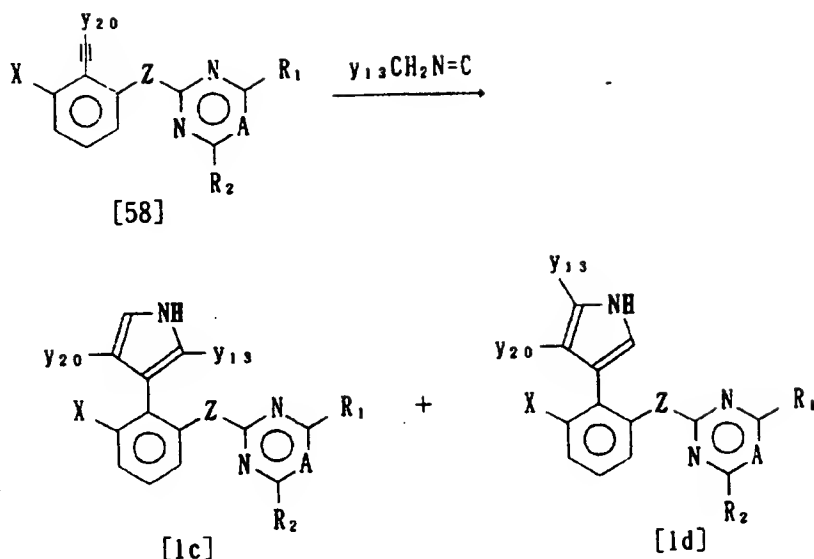


一般式〔56〕で示される化合物とアジ化ナトリウムを適当な溶媒中、好ましくはDMFを用い、室温～溶媒の沸点未満の温度、好ましくは80～120℃で1～24時間反応させることにより製造される。

(以下、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、A、Z、Xは前記の意味を示す。)

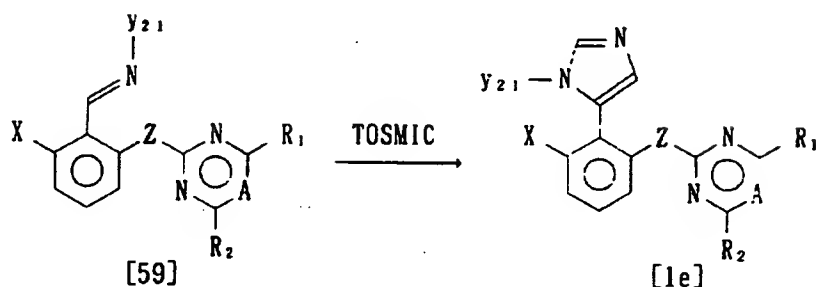
## b) ピロール [1b]、[1c]、[1d] の製造法





一般式〔57〕あるいは〔58〕で示される化合物とTosMIC等のイソシアニド類を、適当な塩基の存在下、溶媒中、室温～溶媒の沸点の温度範囲で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

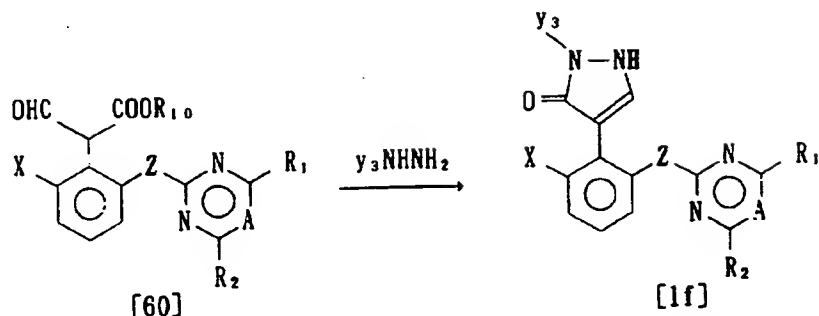
## c) イミダゾール [1e] の製造法



文献公知の方法に従い、一般式〔59〕で示される化合物とTosMICを適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。

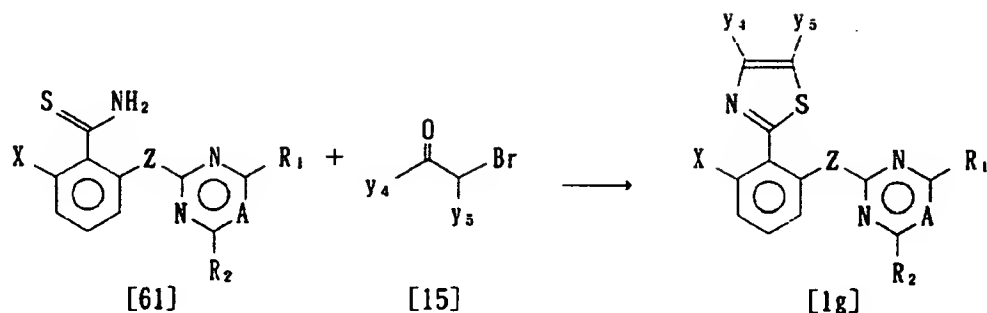
この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

## d) ピラズロン [1f] の製造法



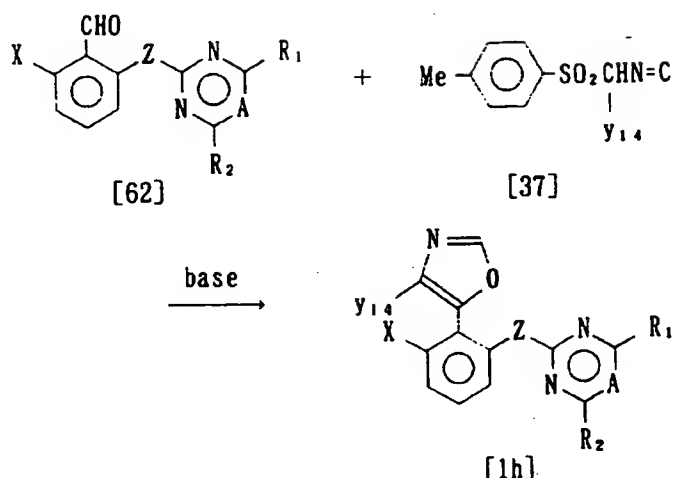
一般式〔60〕で示される化合物とヒドラジン類を適当な塩基の存在下、若しくは非存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

## e) チアゾール [1g] の製造法



一般式〔61〕で示される化合物とプロモケトン〔15〕を適当な塩基の存在下、若しくは非存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

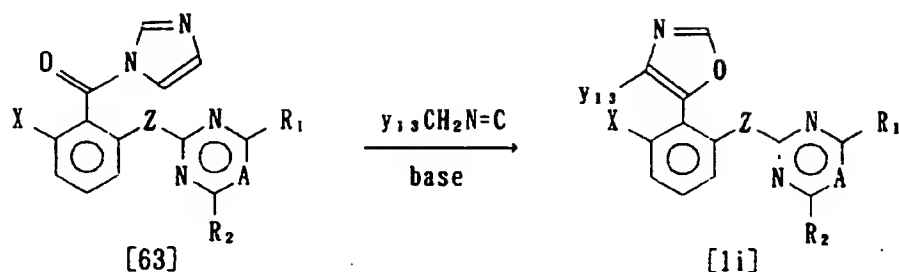
## f) オキサゾール [1h] の製造法



一般式〔62〕で示されるアルデヒドとイソニトリル〔37〕をアルデヒドに対して2等量以上の適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

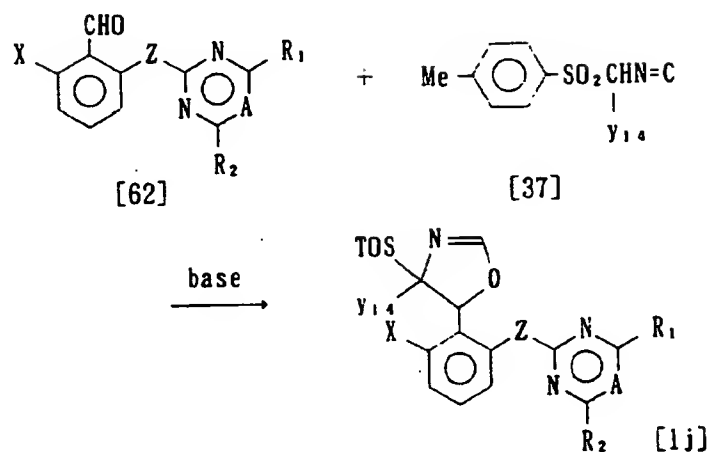


## g) オキサゾール [1 i] の製造法



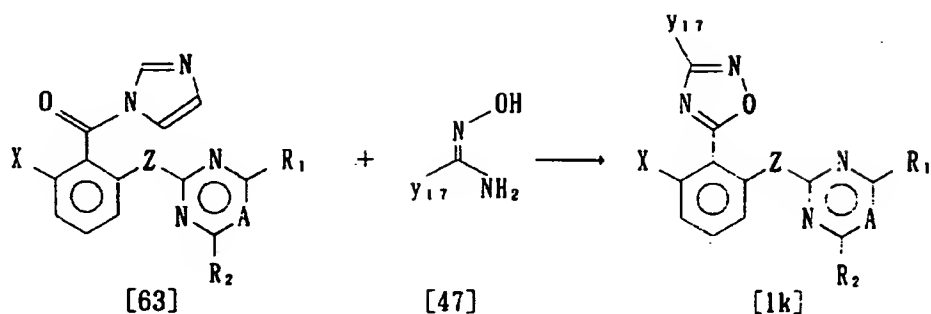
一般式〔63〕で示されるアシルイミダゾールとイソニトリル類を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、 $-78 \sim 80^\circ\text{C}$ の温度で1～24時間反応させることにより〔1 i〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DM SO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

## h) オキサゾリン [1j] の製造法



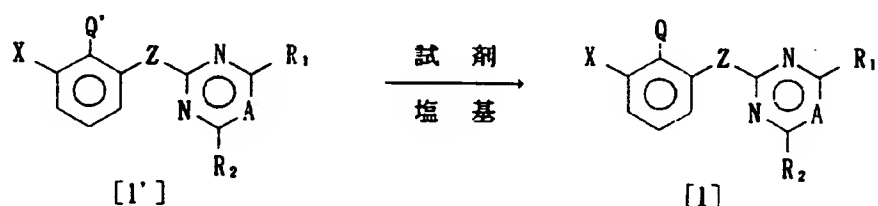
一般式〔62〕で示されるアルデヒドとイソニトリル〔37〕をアルデヒドに対してはば等量の適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、0℃～室温の温度で1～2時間反応させることにより〔1j〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

## i) オキサジアゾール [1k] の製造法



一般式〔63〕で示されるアシルイミダゾールとアミドキシム〔47〕を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、 $-15 \sim 140^{\circ}\text{C}$ の温度で1~24時間反応させることにより〔1k〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

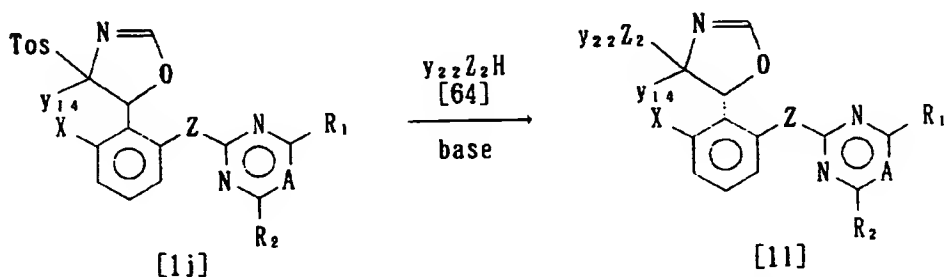
## (製造法-3)



(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、A、Q、X、Zは前記と同じ意味を表し、Q'、X'はそれぞれQ、Xと同意味を示す。)

一般式〔1'〕で示される化合物を、文献公知の方法に従い、適当な塩基、もしくは酸の存在下、無溶媒又は適当な溶媒中、 $-78^{\circ}\text{C}$ ～溶媒の沸点未満の温度で、適当な試剤（例えば、ヨウ化メチル等のアルキル化剤、アセチルクロリドのようなアシル化剤、メタンスルホニルクロリドのようなスルホニル化剤等）と、1～24時間反応させ、ヘテロ環Q上の置換基もしくはベンゼン環上の置換基X'を変換して〔1〕を合成する。

a) オキサゾリン

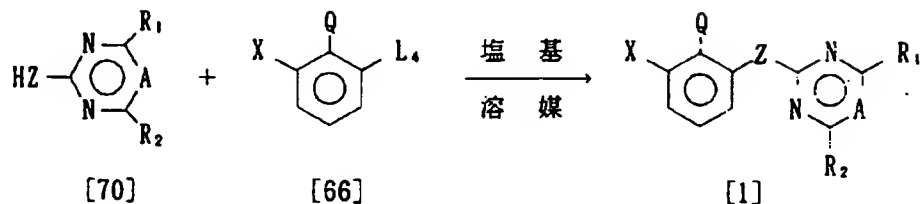


（式中、 $Z_2$  は酸素、硫黄を表し、 $y_{22}$ はアルキル、アリールを表し、 $y_{14}$ は前記と同じ意味を表す。）

一般式〔1j〕の化合物と〔64〕を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、 $-15 \sim 25^{\circ}\text{C}$ の温度で1～24時間反応させることにより〔11〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピル

アミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

(製造法-4)



一般式 [70] (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $Z$  は前記と同じ意味を表す。) の化合物と、一般式 [66] (式中、 $Q$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $n$ 、 $L_4$  は前記と同じ意味を表す。) の化合物を、有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせる。塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DM E 等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、 $0 \sim 90^\circ\text{C}$ 、場合によっては  $120^\circ\text{C}$  で攪拌される。

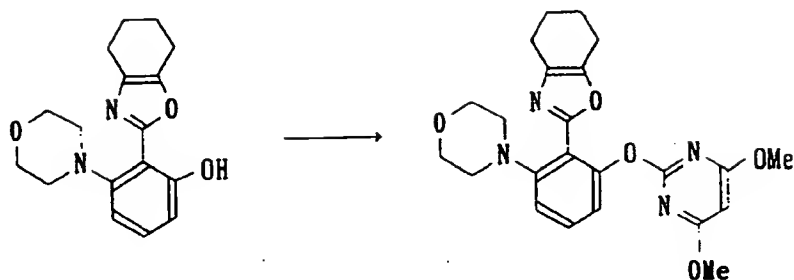
本発明化合物の構造は、IR、NMR、MS 等から決定した。

実施例：

以下、本発明を実施例によりさらに詳細に説明する。

実施例 1

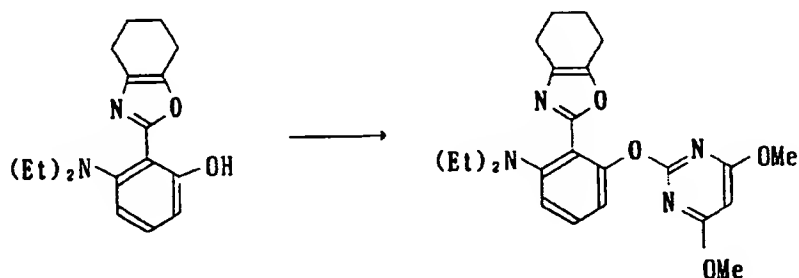
2-[2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-(4-モルホリノ)フェニル]テトラヒドロベンゾオキサゾール(化合物 2-5)の合成



2-〔2-ヒドロキシ-6-(4-モルホリノ)フェニル〕テトラヒドロベンズオキサゾール 40 mg、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン 32 mg、及び炭酸カリウム 55 mgのDMF(1 ml)混合物を80℃で4時間攪拌した。反応後、水を加え、次いで酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、得られた残留物をカラムクロマト(シリカゲル; 溶出液 ヘキサン-酢酸エチル=1-1)で精製し目的物 50 mg、mp=154-6℃を得た。

## 実施例 2

2-〔2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-(N,N-ジエチルアミノ)フェニル〕テトラヒドロベンズオキサゾール(化合物番号1-2)の合成

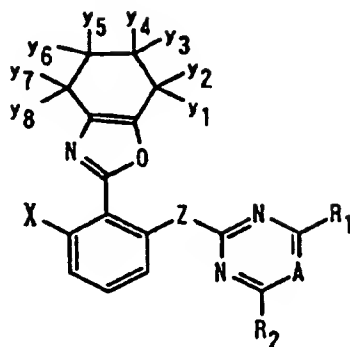


2-(2-ヒドロキシ-6-(N,N-ジエチルアミノ)フェニル)テトラヒドロベンズオキサゾール 110 mg、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホ

ニルピリミジン 84 mg、及び炭酸カリウム 106 mgのDMF (1 ml) 混合物を60℃で15時間攪拌した。反応後、水を加え、次いで酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、得られた残留物をカラムクロマト（シリカゲル；溶出液 ヘキサン-酢酸エチル=3-1）で精製し目的物 70 mgを得た。

上記実施例を含め本発明の化合物の代表例を以下の第1表～第9表に示す。

第 1 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
1-1	NHMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	123-5
1-2	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	88-90
1-3	NEt2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5378(29)
1-4	N(n-Pr)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5448(29)
1-5	N(i-Pr)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-6	N(n-Bu)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-7	N(i-Bu)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-8	N(n-Hex)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-9	N(n-C8H17)2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5198(27)
1-10	N(Me)Et	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-11	N(Me)CH2OMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-12	N(Me)Ph	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	119-120
1-13	N(Me)Bn	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-14	N(Me)CH=O	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-15	N(Me)COHMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	113-5
1-16	N(Me)COOMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-17	N(Me)COPh	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	



第 1 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値	*a
1-18	NMe2	OMe	OMe	H	Me	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-19	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	Me	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-20	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	Me	H	H	H	H	CR3	O		
1-21	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	CR3	O		
1-22	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Me	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-23	NMe2	OMe	OMe	H	H	Me	Me	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-24	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	Me	Me	H	H	H	CR3	O		
1-25	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	Me	Me	CR3	O			
1-26	NMe2	OMe	OMe	H	Et	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-27	NMe2	OMe	OMe	H	H	Et	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-28	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	Et	H	H	H	H	CR3	O		
1-29	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	Et	H	H	CR3	O		
1-30	NMe2	OMe	OMe	H	i-Pr	H	H	H	H	Et	H	H	CR3	O		
1-31	NMe2	OMe	OMe	H	H	i-Pr	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-32	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	i-Pr	H	H	H	H	CR3	O		
1-33	NMe2	OMe	OMe	H	=O	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-34	NMe2	OMe	OMe	H	H	=O	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-35	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	=O	H	H	H	H	CR3	O		
1-36	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	=O	H	H	CR3	O		
1-37	NMe2	OMe	OMe	H	=O	H	H	Me	H	H	H	H	CR3	O		
1-38	NMe2	OMe	OMe	H	H	=O	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-39	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	=O	H	H	H	H	CR3	O		
1-40	NMe2	OMe	OMe	H	=O	H	H	Me	Me	H	H	H	CR3	O		
1-41	NMe2	OMe	OMe	H	=O	Me	Me	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-42	NMe2	OMe	OMe	H	Me	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O		
1-43	NMe2	OMe	OMe	H	H	Me	H	H	H	H	H	H	CR3	O		

第 1 表 (続き)

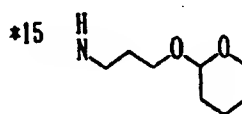
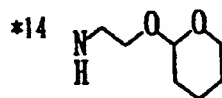
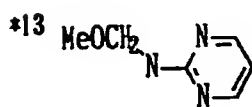
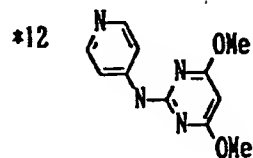
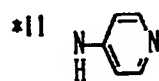
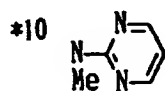
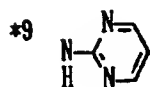
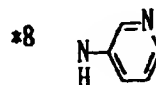
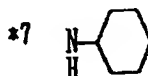
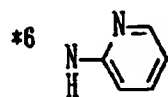
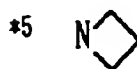
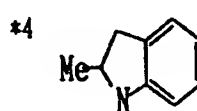
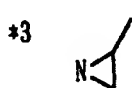
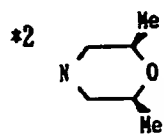
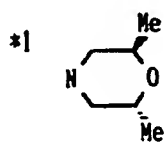
No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
1-44	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CR3	O	
1-45	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	CR3	O	
1-46	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	N	O	
1-47	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	NH	
1-48	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	S	
1-49	*1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gum
1-50	*2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5495(27)
1-51	*3	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gum
1-52	*4	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
1-53	N(COMe)Ph	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	143-4
1-54	NHPh	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	166-8
1-55	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gum
1-56	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gum
1-57	N(Et)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5465(24)
1-58	N(Pr)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5452(24.5)
1-59	N(Pr-i)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5230(22.5)
1-60	NHPh(4-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	47-52
1-61	NHPh(4-Me)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	144-6
1-62	NHBn	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	135-7
1-63	NHPh(3-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	169-170
1-64	N(Me)Bn	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	90-2
1-65	*5	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5804(33)
1-66	NHPh(2-Me)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	149-152
1-67	NHCONHEt	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	135-7
1-68	NHCONHPh	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	190-2
1-69	NHCONHPh(3-Cl, 4-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	194-6

第 1 表 (続き)

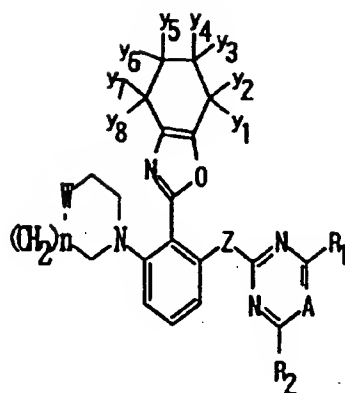
No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
1-70	NHCSNH <sub>2</sub> Et	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		149-151
1-71	NHPh (4-OMe)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		125-7
1-72	NHPh (4-Bu)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.665(27)
1-73	NHCONHPh (3-CF <sub>3</sub> )	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		199-200
1-74	NHCONHPh (4-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		202-3
1-75	NHPh (4-NO <sub>2</sub> )	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.643(34)
1-76	NHCONHPh (3-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		201-3
1-77	NHBu-t	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.567(24)
1-78	NHPh (2-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		180-2
1-79	NHPh (3-Me)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		168-170
1-80	*6	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		177-9
1-81	NHEt	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		102-4
1-82	NHPr-i	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.5773(24.5)
1-83	*7	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.5882(24)
1-84	NHPh (2-Cl, 4-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		149-152
1-85	*8	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		170-2
1-86	N(Et)Bn	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		gub
1-87	NHPh (3-Cl, 5-Cl)	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		160-1
1-88	*9	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		170-2
1-89	*10	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		120-5
1-90	*11	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		45-64
1-91	*12	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		188-192
1-92	*13	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		gub
1-93	*14	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.550(25.5)
1-94	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.5701(25.5)
1-95	*15	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3 O		1.5748(26)

第 1 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値	*a
1-96	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	106-7	
1-97	N(COMe)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCOMe	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5415(24.5)	



第 2 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	W	n	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
2-1	CH2	0	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	137-9
2-2	CH2	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	108-110
2-3	CH2	2	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	1.5656(32)
2-4	CH2	3	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-5	O	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	155-7
2-6	S	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	129-131
2-7	SO	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	142-4
2-8	SO2	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	156-9
2-9	NH	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	52-5
2-10	NMe	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-11	NEt	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-12	N(n-Bex)	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-13	N(n-C8H17)	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-14	N(CH2OMe)	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-15	NPh	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-16	NBn	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-17	NCHO	1	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	159-160

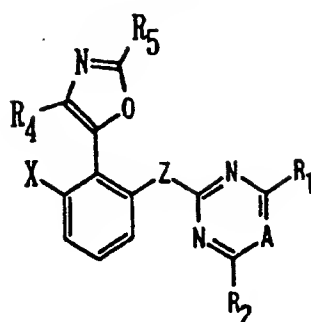
第 2 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
2-18	NCOMe	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-19	NCOOMe	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-20	NCOPh	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-21	NCONHPh	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	213-5
2-22	NCSNHPh	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-23	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CR3	O	
2-24	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	CR3	O	
2-25	O	1 OMe	OMe	H	Me	Me	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-26	O	1 OMe	OMe	H	H	H	Me	Me	H	H	H	H	CR3	O	
2-27	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	Me	Me	H	H	CR3	O	
2-28	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	Me	Me	CR3	O	
2-29	O	1 OMe	OMe	H	Et	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-30	O	1 OMe	OMe	H	H	H	Et	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-31	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	Et	H	H	H	CR3	O	
2-32	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	Et	H	CR3	O	
2-33	O	1 OMe	OMe	H	i-Pr	H	H	H	H	H	Et	H	CR3	O	
2-34	O	1 OMe	OMe	H	H	H	i-Pr	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-35	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	i-Pr	H	H	H	CR3	O	
2-36	O	1 OMe	OMe	H	=O	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-37	O	1 OMe	OMe	H	H	H	=O	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-38	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	=O	H	H	H	CR3	O	
2-39	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	=O	H	CR3	O	
2-40	O	1 OMe	OMe	H	=O	Me	Me	H	H	H	H	H	CR3	O	
2-41	O	1 OMe	OMe	H	H	H	=O	Me	Me	H	H	H	CR3	O	
2-42	O	1 OMe	OMe	H	=O	H	H	Me	Me	H	H	H	CR3	O	
2-43	O	1 OMe	OMe		=O	H	H	Me	Me	H	H	N	O		

第 2 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	y3	y4	y5	y6	y7	y8	A	Z	物性値 *a
2-44	O	1 OMe	OMe		=O	Me	Me	H	H	H	H	H	N	O	
2-45	CH2	1 OMe	OMe		Me	H	H	H	H	H	H	H	N	O	
2-46	CH2	1 OMe	OMe		H	H	Me	H	H	H	H	H	N	O	
2-47	CH2	1 OMe	OMe		H	H	H	H	Me	H	H	H	N	O	
2-48	CH2	1 OMe	OMe		H	H	H	H	H	H	Me	H	N	O	
2-49	O	1 OMe	OMe		H	H	H	H	H	H	H	H	N	O	
2-50	CH2	1 OMe	OMe		H	H	H	H	H	H	H	H	N	O	
2-51	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	NH	
2-52	O	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	S	
2-53	NCOOBu-t	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	63-5
2-54	NCONHEt	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	75-7
2-55	NCOOEt	1 OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gun
2-56	O	1 OCF2H	OCF2H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	93-5
2-57	O	1 OMe	OMe	H	H	H	Bu-t	H	H	H	H	H	CR3	O	gun
2-58	O	1 Cl	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	164-6
2-59	O	1 Me	NHMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	gun
2-60	O	1 OMe	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	136-7
2-61	O	1 OMe	N(Me)2	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	181-3
2-62	O	1 OMe	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	179-182
2-63	O	1 OMe	CN	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	170
2-64	O	1 OMe	-OCH2CH2-	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CR3	O	163-5

第 3 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
3-1	NH <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-2	NMe <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-3	NEt <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-4	N(n-Pr) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-5	N(i-Pr) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-6	N(n-Bu) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-7	N(i-Bu) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-8	N(n-Hex) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-9	N(n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> ) <sub>2</sub>	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-10	N(Me)Et	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-11	N(Me)CH <sub>2</sub> OMe	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-12	N(Me)Ph	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-13	N(Me)Bu	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-14	N(Me)CHO	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-15	N(Me)COMe	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-16	N(Me)COOMe	OMe	OMe	H		H	CR3	O	
3-17	N(Me)COPh	OMe	OMe	H		H	CR3	O	



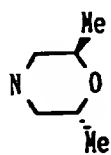
第 3 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	A	Z	物性値 *a
3-18	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Me	CR3	O	
3-19	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Ph	CR3	O	
3-20	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph	CR3	O	
3-21	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-Cl	CR3	O	
3-22	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-OMe	CR3	O	
3-23	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-NH2	CR3	O	
3-24	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Ph	CR3	O	
3-25	NMe2	OMe	OMe	H	H	CHO	CR3	O	
3-26	NMe2	OMe	OMe	H	H	COOMe	CR3	O	
3-27	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-CN	CR3	O	
3-28	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-COOEt	CR3	O	
3-29	NMe2	OMe	OMe	H	H	3-Pyridyl	CR3	O	
3-30	NMe2	OMe	OMe	H	H	Bn	CR3	O	
3-31	NMe2	OMe	OMe	H	H	Et	CR3	O	
3-32	NMe2	OMe	OMe	H	H	C(Me)=CH-Me	CR3	O	
3-33	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Me	CR3	O	
3-34	*1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
3-35	*2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
3-36	*4	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
3-37	*5	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
3-38	*6	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
3-39	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	N	O	
3-40	NMe2	OMe	OMe	Me	Me	Me	N	O	1.5568(26.5)
3-41	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph	N	O	

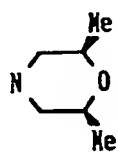
第 3 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	y1	y2	A	Z	物性値 *a
3-42	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-Cl	N	O	
3-43	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-OMe	N	O	
3-44	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-NH2	N	O	
3-45	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-Ph	N	O	
3-46	NMe2	OMe	OMe	H		CHO	N	O	
3-47	NMe2	OMe	OMe	H		COOMe	N	O	
3-48	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-CN	N	O	
3-49	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-COOEt	N	O	
3-50	NMe2	OMe	OMe	H		3-Pyridyl	N	O	
3-51	NMe2	OMe	OMe	H		Bn	N	O	
3-52	NMe2	OMe	OMe	H		Et	N	O	
3-53	NMe2	OMe	OMe	H		C(Me)=CH-Me	N	O	
3-54	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-Me	N	O	

\*1



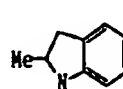
\*2



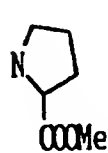
\*3



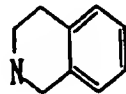
\*4



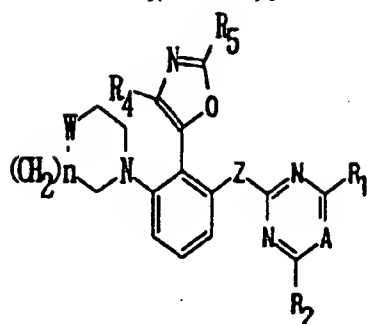
\*5



\*6



第 4 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

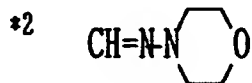
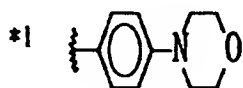
No.	W	n	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値	*a
4-1	CH <sub>2</sub>	0	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-2	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-3	CH <sub>2</sub>	2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-4	CH <sub>2</sub>	3	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-5	O	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	148-9	
4-6	S	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-7	NH	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-8	NMe	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	oil	
4-9	NEt	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-10	N(n-Hex)	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-11	N(n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> )	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-12	N(CH <sub>2</sub> OMe)	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-13	NPh	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-14	NBu	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-15	NCHO	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-16	NCOMe	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
4-17	NCOOMe	1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		

第 4 表 (続き)

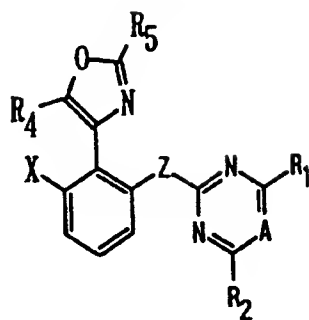
No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
4-18	NCOPh	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-19	NCONHPh	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-20	NCSNHPh	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-21	O	1	OMe	OMe	H	Me	CR3	O	gum
4-22	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-23	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	159-161
4-24	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-25	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-26	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-27	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-28	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-29	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-30	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-31	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-32	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	147-151
4-33	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-34	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-35	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-36	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	
4-37	O	1	OMe	OMe	H	Me	CR3	O	
4-38	O	1	OMe	OMe	H	Et	CR3	O	
4-39	O	1	OMe	OMe	H	Me	CR3	O	
4-40	O	1	OMe	OMe	H	Me	CR3	O	
4-41	O	1	OMe	OMe	H	H	N	O	

第 4 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値	*a
4-42	O	1	OMe	OMe	Me	H	N	O		
4-43	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	Me	CR3	O		
4-44	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	Me	Me	CR3	O		
4-45	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	Ph	CR3	O		
4-46	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	Ph-4-Cl	CR3	O		
4-47	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	CH=CH-Ph	CR3	O		
4-48	CH <sub>2</sub>	1	OMe	OMe	H	CH=CH-COOEt	CR3	O		
4-49	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	NH		
4-50	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	S		
4-51	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	gum	
4-52	O	1	OMe	OMe	H	H	CR3	O	1.5918(32)	
4-53	O	1	OMe	OMe	H	H	CH=CHCOOEt	CR3	O	1.5872(26)
4-54	O	1	OMe	OMe	H	H	CH <sub>2</sub> CONHPh(3-Cl)	CR3	O	1.5676(27)



第 5 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

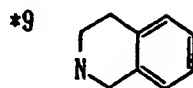
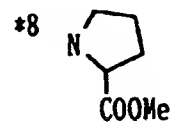
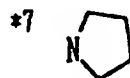
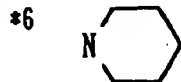
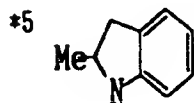
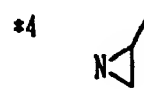
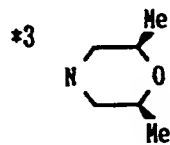
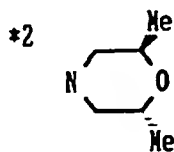
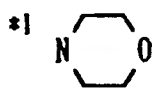
No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
5-1	NHMe	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-2	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-3	NEt2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-4	N(n-Pr)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-5	N(i-Pr)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-6	N(n-Bu)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-7	N(i-Bu)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-8	N(n-Hex)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-9	N(n-C8H17)2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-10	N(Me)Et	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-11	N(Me)CH2OMe	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-12	N(Me)Ph	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-13	N(Me)Bn	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-14	N(Me)CHO	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-15	N(Me)COMe	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-16	N(Me)COOMe	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-17	N(Me)COPh	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	

第 5 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値	*a
5-18	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Me	CR3	O		
5-19	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Ph	CR3	O		
5-20	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph	CR3	O		
5-21	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-Cl	CR3	O		
5-22	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-OMe	CR3	O		
5-23	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-NH2	CR3	O		
5-24	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Ph	CR3	O		
5-25	NMe2	OMe	OMe	H	H	CHO	CR3	O		
5-26	NMe2	OMe	OMe	H	H	COOMe	CR3	O		
5-27	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-CN	CR3	O		
5-28	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-COOEt	CR3	O		
5-29	NMe2	OMe	OMe	H	H	3-Pyridyl	CR3	O		
5-30	NMe2	OMe	OMe	H	H	Bn	CR3	O		
5-31	NMe2	OMe	OMe	H	H	Et	CR3	O		
5-32	NMe2	OMe	OMe	H	H	C(Me)=CH-Me	CR3	O		
5-33	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Me	CR3	O		
5-34	*1	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-35	*2	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-36	*3	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-37	*4	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-38	*5	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-39	*6	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-40	*7	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		
5-41	*8	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O		

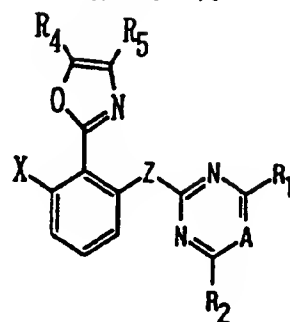
第 5 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
5-42	*9	OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	
5-43	NMe2	OMe	OMe	H	H	H	N	O	
5-44	NMe2	OMe	OMe	Me	Me	Me	N	O	
5-45	NMe2	OMe	OMe	H	Ph	Ph	N	O	
5-46	NMe2	OMe	OMe	H	Ph-4-Cl	Ph-4-Cl	N	O	
5-47	NMe2	OMe	OMe	H	Ph-4-OMe	Ph-4-OMe	N	O	
5-48	NMe2	OMe	OMe	H	Ph-4-NH2	Ph-4-NH2	N	O	
5-49	NMe2	OMe	OMe	H	CH=CH-Ph	CH=CH-Ph	N	O	
5-50	NMe2	OMe	OMe	H	CHO	CHO	N	O	
5-51	NMe2	OMe	OMe	H	COOMe	COOMe	N	O	
5-52	NMe2	OMe	OMe	H	CH=CH-CN	CH=CH-CN	N	O	
5-53	NMe2	OMe	OMe	H	CH=CH-COOEt	CH=CH-COOEt	N	O	
5-54	NMe2	OMe	OMe	H	3-Pyridyl	3-Pyridyl	N	O	
5-55	NMe2	OMe	OMe	H	Bn	Bn	N	O	
5-56	NMe2	OMe	OMe	H	Et	Et	N	O	
5-57	NMe2	OMe	OMe	H	C(Me)=CH-Me	C(Me)=CH-Me	N	O	
5-58	NMe2	OMe	OMe	H	CH=CH-Me	CH=CH-Me	N	O	





第 6 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
6-1	NHMe	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-2	NMe2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-3	NEt2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-4	N(n-Pr)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-5	N(i-Pr)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-6	N(n-Bu)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-7	N(i-Bu)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-8	N(n-Hex)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-9	N(n-C8H17)2	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-10	N(Me)Et	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-11	N(Me)CH2OMe	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-12	N(Me)Ph	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-13	N(Me)Bn	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-14	N(Me)CHO	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-15	N(Me)COMe	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-16	N(Me)COOMe	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	
6-17	N(Me)COPh	OMe	OMe	H		Me	CR3	O	

第 6 表 (続き)

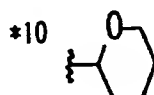
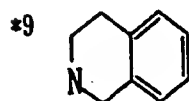
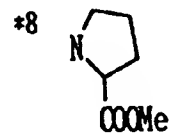
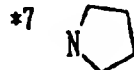
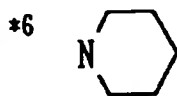
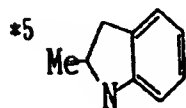
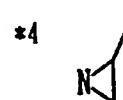
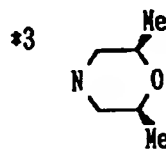
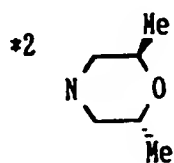
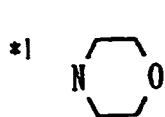
No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値 *a
6-18	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Me		CR3 O	
6-19	NMe2	OMe	OMe	H	Me	Ph		CR3 O	
6-20	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph		CR3 O	
6-21	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-Cl		CR3 O	
6-22	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-OMe		CR3 O	
6-23	NMe2	OMe	OMe	H	H	Ph-4-NH2		CR3 O	
6-24	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Ph		CR3 O	
6-25	NMe2	OMe	OMe	H	H	CHO		CR3 O	
6-26	NMe2	OMe	OMe	H	H	COOMe		CR3 O	
6-27	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-CN		CR3 O	
6-28	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-COOEt		CR3 O	
6-29	NMe2	OMe	OMe	H	H	3-Pyridyl		CR3 O	
6-30	NMe2	OMe	OMe	H	H	Bn		CR3 O	
6-31	NMe2	OMe	OMe	H	H	Et		CR3 O	
6-32	NMe2	OMe	OMe	H	H	C(Me)=CH-Me		CR3 O	
6-33	NMe2	OMe	OMe	H	H	CH=CH-Me		CR3 O	
6-34	*1	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-35	*2	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-36	*3	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-37	*4	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-38	*5	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-39	*6	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-40	*7	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	
6-41	*8	OMe	OMe	H	H	Me		CR3 O	

第 6 表 (続き)

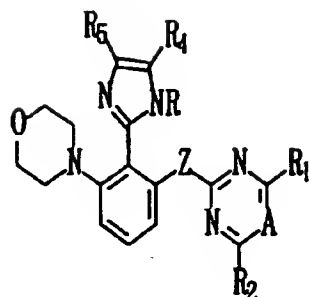
No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値	*a
6-42	*9	OMe	OMe	H		Me		CR3	O	
6-43	NMe2	OMe	OMe	H		Me		N	O	
6-44	NMe2	OMe	OMe	Me		Me		N	O	
6-45	NMe2	OMe	OMe	H		Ph		N	O	
6-46	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-Cl		N	O	
6-47	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-OMe		N	O	
6-48	NMe2	OMe	OMe	H		Ph-4-NH2		N	O	
6-49	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-Ph		N	O	
6-50	NMe2	OMe	OMe	H		CHO		N	O	
6-51	NMe2	OMe	OMe	H		COOMe		N	O	
6-52	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-CN		N	O	
6-53	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-COOEt		N	O	
6-54	NMe2	OMe	OMe	H		3-Pyridyl		N	O	
6-55	NMe2	OMe	OMe	H		Bn		N	O	
6-56	NMe2	OMe	OMe	H		Et		N	O	
6-57	NMe2	OMe	OMe	H		C(OMe)=CH-Me		N	O	
6-58	NMe2	OMe	OMe	H		CH=CH-Me		N	O	
6-59	*1	OMe	OMe	H	Ph	Me		CR3	O	91-2
6-60	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2O-*10		CR3	O	gum
6-61	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2OH		CR3	O	126-8
6-62	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2OCONHPh (3-Cl)		CR3	O	64-5
6-63	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2OCONHPh (3-CF3)		CR3	O	65-70
6-64	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2OCONHPh (3-Cl, 4-Cl)		CR3	O	62-4
6-65	*1	OMe	OMe	H	Ph	CH2OPh (3-Cl)		CR3	O	42-5

第 6 表 (続き)

No.	X	R1	R2	R3	R4	R5	A	Z	物性値	*a
6-66 *1		OMe	OMe	H	Ph	CH <sub>2</sub> CONHPh	CR3	O	gum	
6-67 *1		OMe	OMe	H	Ph	CH <sub>2</sub> COPh(3-Cl)	CR3	O	oil	
6-68 *1		OMe	OMe	H	Ph	Ph	CR3	O	52-6	
6-69 *1		OMe	OMe	H	Me	Ph	CR3	O	178-180	
6-70 *1		OMe	OMe	H	Me	H	CR3	O	99-100.5	
6-71 *1		OMe	OMe	H	Ph	H	CR3	O	gum	
6-72 *1		OMe	OMe	H	H	H	CR3	O	148.5-9.5	
6-73 *1		OMe	OMe	H	Me	Me	CR3	O	153	
6-74 *1		OMe	OMe	H	Bu-t	H	CR3	O	1.5512(25)	
6-75 *1		OMe	OMe	H	OEt	Pr-i	CR3	O	93-4	

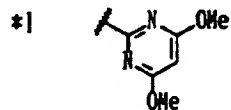


第 7 表

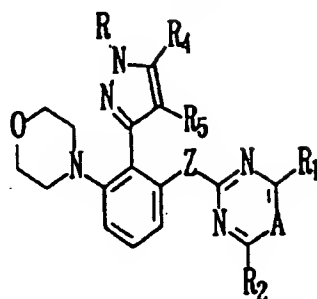


\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R	R4	R5	R1	R2	R3	A	Z	物性値 *a
7-1	H	H	H	OMe	OMe	H	CR3	O	
7-2	H	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	141-3
7-3	*1	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	54-7
7-4	CH(Me)OEt	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	122-4
7-5	CH2OCOBu-t	H	CF3	OMe	OMe	H	CR3	O	gum
7-6	COOEt	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	126-7
7-7	CH(Me)OCON(Me)2	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	1.5618(26)

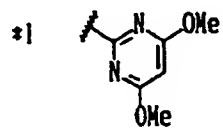


第 8 表

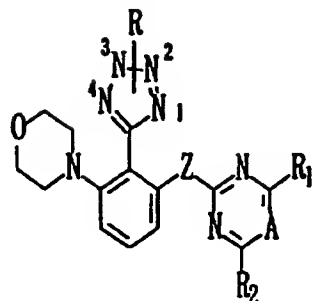


\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R	R4	R5	R1	R2	R3	A	Z	物性値	*a
8-1	H	H	H	OMe	OMe	H	CR3	O		
8-2	H	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	193-5	
8-3	CH(Me)OEt	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	1.506(24)	
8-4	*1	CF3	H	OMe	OMe	H	CR3	O	1.5443(28)	



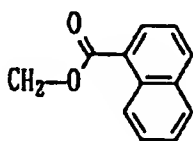
第 9 表



\*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R	R1	R2	R3	A	Z	物性値	*a
9-1	H	OMe	OMe	H	CR3	O	80-84	
9-2	*1 (1- & 2- mixture)	OMe	OMe	H	CR3	O	112-4	
9-3	1-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	OMe	OMe	H	CR3	O	131-133.5	
9-4	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	OMe	OMe	H	CR3	O	gum	
9-5	1-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	OMe	OMe	H	CR3	O	149-151	
9-6	1-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	OMe	OMe	H	CR3	O	gum	

\*1



本発明化合物（式〔I〕で表される化合物又はその塩）は畑作条件で、土壌処理、茎葉処理のいずれの方法でも高い除草活性を示し、アキノエノコログサ、イチビ、イヌビユ等の各種畑雑草に有効で、トウモロコシ、ムギ、大豆、ワタ等の作物に選択性を示す化合物も含まれている。

また、本発明化合物は、作物、観賞用植物、果樹等の有用植物に対し、生育抑制作用を示す化合物も含まれている。

また本発明化合物は、ノビエ、タマガヤツリ、オモダカ、ホタルイ等の各種水田雑草に対し、優れた殺草効力を有し、イネに選択性を示す。

更に本発明化合物は果樹園、芝生、線路端、空き地等の雑草の防除にも適用することができる。

本発明化合物には植物成長調節作用を有するものも含まれ、また本発明化合物の中間体化合物の中には除草活性を有するものも含まれる。

本発明の除草剤は、本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、フロアブル等の形態で使用することもできる。添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粉、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ペントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。

本発明除草剤における有効成分濃度は前述した製剤の形により種々の濃度に変



化するものであるが、例えば、水和剤に於いては、5～90%、好ましくは10～85%：乳剤に於いては、3～70%、好ましくは5～30%：粒剤に於いては、0.01～30%、好ましくは、0.05%～10%の濃度が用いられる。

このようにして得られた水和剤、乳剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液或いは乳濁液として、粒剤はそのまま雑草の発芽前又は発芽後に土壤に散布処理もしくは混和処理される。実際に本発明除草剤を適用するに当たっては10アール当たり有効成分0.1g以上の適当量が施用される。

又、本発明除草剤は公知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調整剤等と混合して使用することも出来る。特に、除草剤と混合使用することにより、使用薬量を減少させることが可能である。又、省力化をもたらすのみならず、混合薬剤の相乗作用により一層高い効果も期待できる。その場合、複数の公知除草剤との組合せも可能である。

本発明除草剤と混合使用するにふさわしい薬剤としては、ベンチオカーブ、モリネート、ジメピペレート等のカーバメイト系除草剤、チオカーバメイト系除草剤、ブタクロール、プレチラクロール、メフェナセット等の酸アミド系除草剤、クロメトキシニル、ピフェノックス等のジフェニルエーテル系除草剤、アトラジン、シアナジン等のトリアジン系除草剤、クロルスルフロン、スルホメチュロン-メチル等のスルホニルウレア系除草剤、MCP、MCPB等のフェノキシアルカンカルボン酸系除草剤、ジクロホップ-メチル等のフェノキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、フルアジホップブチル等のピリジルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、トリフルラリン、ベンジメタリン等のジニトロアニリン系除草剤、リニュロン、ジウロン等のウレア系除草剤、ベンゾイルプロップエチル、フランプロップエチル等のベンゾイルアミノプロピオン酸系除草剤、イマザキン等のイミダゾリノン系除草剤、その他として、ピペロホス、ダイムロン、ペンタゾン、ダイフェンゾコート、ナプロアニリド、エトベンザニド、トリアゾフェナミド、キンクロラック、更に、セトキシジム、クレソジム等のシクロヘキサジオン系の除草剤等が挙げられる。又、これらの組み合わせた物に植物油及び油濃縮

物を添加することも出来る。

次に、本発明除草剤に関する製剤例を若干示すが、有効成分化合物、添加物及び添加割合は、本実施例にのみ限定されることなく、広い範囲で変更可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

#### 実施例 3 水和剤

本発明化合物	20部
ホワイトカーボン	20部
ケイソウ土	52部
アルキル硫酸ソーダ	8部

以上を均一に混合、微細に粉碎して、有効成分20%の水和剤を得た。

#### 実施例 4 乳剤

本発明化合物	20部
キシレン	55部
ジメチルホルムアミド	15部
ポリオキシエチレンフェニルエーテル	10部

以上を混合、溶解して有効成分20%の乳剤を得た。

#### 実施例 5 粒剤

本発明化合物	5部
タルク	40部
クレー	38部
ベントナイト	10部
アルキル硫酸ソーダ	7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得た。

次に本発明除草剤の効果に関する試験例を示す。

除草効果は下記の調査基準に従って調査し、殺草指数で表した。

#### 調査基準

殺 草 率	殺 草 指 数
0 %	0
20 ~ 29 %	2
40 ~ 49 %	4
60 ~ 69 %	6
80 ~ 89 %	8
100 %	10

また、1、3、5、7、9の数値は、各々0と2、2と4、4と6、6と8、8と10の中間の値を示す。

(無処理区の地上部生草重－処理区の地上部生草重)

$$\text{殺草率 (\%)} = \frac{\text{無処理区の地上部生草重} - \text{処理区の地上部生草重}}{\text{無処理区の地上部生草重}} \times 100$$

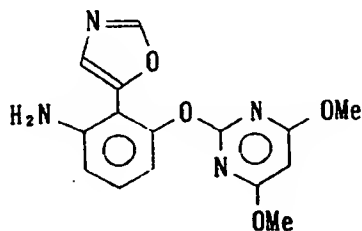
#### 試験例1 畑作土壌処理

表面積が250 cm<sup>2</sup> のプラスチックポットに畑土壌を充填し、これにアキノエノコログサ、イヌビユ、イチビの種子を播種し、その上に0.5 cmの覆土をした。翌日実施例3に示した水和剤の希釈液を、その有効成分がha当り250 gとなるように土壌表面に均一に散布し、処理3週間後に除草効果を調査し、その結果を第10表に示した。

第 10 表

化合物番号	薬 量 g / h a	アキノエノ コログサ	イヌビユ	イチビ
1 - 1	2 5 0	8	9	8
1 - 2	"	9	9	8
1 - 9	"	8	9	9
2 - 5	"	8	1 0	8
比較剤 A	"	0	7	0

比較例 A



WO 94 / 17059 記載の化合物

## 試験例 2 水田茎葉処理

表面積が 100 cm<sup>2</sup> のポットに水田土壌を充填し、代掻き後、ノビエ、タマガヤツリおよびオモダカの種子を播種したのち、2 葉期のイネを移植した。これを温室内で生育させ、各雑草が 1 ~ 1.5 葉期になった時点で水深 3 cm に湛水

した後、各供試化合物の実施例 3 で示した水和剤の水希釈液を、有効成分が 62 . 5 g / h a となるように滴下処理した。処理 3 週間後に除草効果およびイネの薬害程度を調査し、その結果を第 11 表に示した。

第 11 表

化合物番号	薬量 g/h a	ノビエ	タマガヤツリ	オモダカ	移植イネ
1-1	62.5	7	8	8	0
1-2	"	8	10	9	0
1-3	"	8	9	9	3
1-9	"	8	8	8	2
1-49	"	9	8	8	0
1-50	"	10	8	8	0
2-2	"	10	—	8	2
2-5	"	10	8	8	3
比較剤 A	62.5	0	0	0	0
	125	4	4	4	1

産業上の利用可能性：

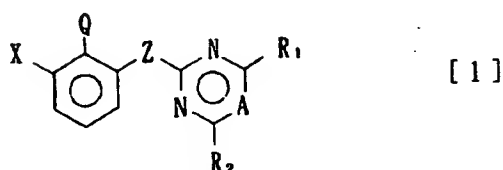
本発明化合物は畑作条件で、土壌処理、茎葉処理のいずれの方法でも高い除草活性を示し、アキノエノコログサ、イチビ、イヌビユ等の各種畑雑草に有効で、

トウモロコシ、ムギ、大豆、ワタ等の作物に選択性を示す化合物が含まれている。また、本発明化合物には、作物、観賞用植物、果樹等の有用植物に対し、生育抑制作用を示す化合物も含まれている。また本発明化合物は、ノビエ、タマガヤツリ、オモダカ、ホタルイ等の各種水田雑草に対し、優れた殺草効力を有し、イネに選択性を示す化合物が含まれている。更に本発明化合物は果樹園、芝生、線路端、空き地等の雑草の防除にも適用することができる。

従って、本発明化合物を含有する組成物は除草剤として有用である。

## 請 求 の 範 囲

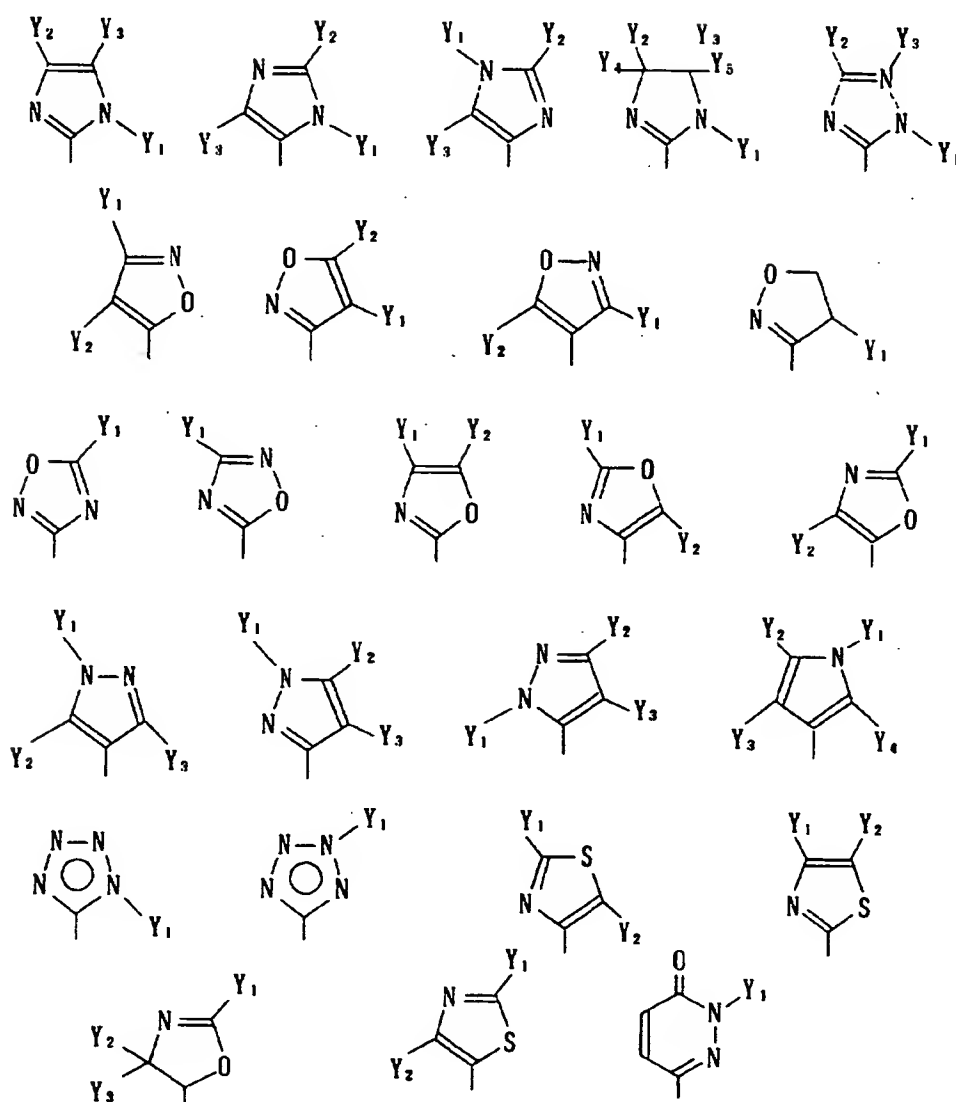
1. 一般式〔1〕で表される化合物又はその農園芸学上許容される塩。



〔式中、AはN又はCR<sub>3</sub>を表し、ZはO又はSを表し、Qは炭素原子でベンゼン環と結合している、N、O、もしくはSを同一または相異なって1～4個含む置換基を有していてもよい5～6員のヘテロ環基を表し、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>は各々独立して水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1-6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、ハロゲン原子又はシアノ基を表し、R<sub>3</sub>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、ホルミル基、アシル基を表すか、又はR<sub>2</sub>と一緒に環を形成していても良く、Xは、式NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>（式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は各々独立して、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ヒドロキシC<sub>2-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されてもよいヘテロ環カルボニル基を表すか、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が一緒になって環を形成してもよい。但し、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が共にC<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、水酸基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、ハロC<sub>1-6</sub>アルコキシ基又はアシルオキシ基ではない。）を表す。〕



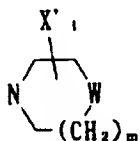
2. 一般式〔1〕において、Qが式



〔式中、 $Y_1 \sim Y_5$  は、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{3-7}$  シクロアルキル基、ハロ $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_2 \sim 6$  アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、アシルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基、ヒドロキシル基、カルボキシル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコ

キシ基、置換されても良いベンジルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、ハロ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $C_{2-6}$  アルケニルチオ基、 $C_{2-6}$  アルキニルチオ基、アシルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、アミノオキシ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いフェニルチオ基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されても良いヘテロ環オキシ基およびヘテロ環チオ基を表し、又、2つの  $Y_1 \sim Y_5$  で炭素環、又はヘテロ環を形成してもよい。) で表されるヘテロ環基の群から選ばれる1種である請求項1に記載の化合物。

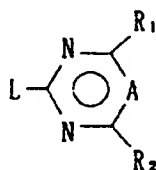
3. 一般式〔1〕において、Xが式  $NR_4$   $R_5$  であり、 $R_4$  及び  $R_5$  は各々独立して、 $C_{1-12}$  アルキル基であるか、又は一緒になって、式



(式中、WはO、S、SO、SO<sub>2</sub>、CR<sub>6</sub> 及びNR<sub>7</sub> を表し、X' 及びR<sub>6</sub> は水素原子、 $C_{1-12}$  アルキル基、 $C_{3-7}$  シクロアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、ヒドロキシ  $C_{2-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、アミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、水酸基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、ハロ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基、アシル基、アミノ基又はカルボキシ基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を

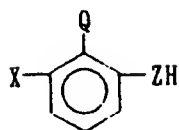
表し、 $R_1$  は水素原子、 $C_{1-12}$ アルキル基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、ヒドロキシ $C_{2-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、アミノ $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されてもよいヘテロ環カルボニル基を表し、 $m$ は0または1～3の整数を表す。)である請求項1に記載の化合物。

#### 4. 一般式〔2〕



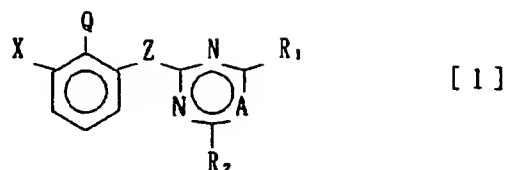
〔2〕

(式中、 $A$ は $N$ 、又は $CR_3$ を表し、 $R_1$ 、 $R_2$ は各々独立して水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、ハロ $C_{1-6}$ アルキル基、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、ハロゲン原子又はシアノ基を表し、 $R_3$ は水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、ホルミル基、アシル基を表すか、又は $R_2$ と一緒になって環を形成していても良く、 $L$ はハロゲン原子又はアルキルスルホニル基を表す。)で表される化合物と、一般式〔3〕



[3]

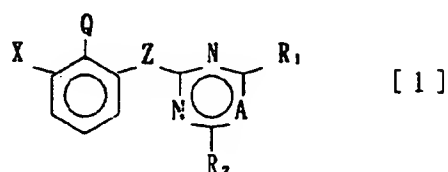
〔式中、Qは炭素原子でベンゼン環と結合している、N、O、もしくはSを同一または相異なって1～4個含む置換基を有していてもよい5～6員のヘテロ環を表し、Xは、式  $\text{NR}_4$ 、 $\text{R}_5$ （式中、 $\text{R}_4$  及び  $\text{R}_5$  は各々独立して、水素原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{3-7}$  シクロアルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルチオ  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルスルホニル  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルキニル基、ヒドロキシ  $\text{C}_{2-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、アミノ  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、又は置換されてもよいヘテロ環カルボニル基を表すか、 $\text{R}_4$  と  $\text{R}_5$  が一緒になって環を形成してもよい。但し、 $\text{R}_4$  と  $\text{R}_5$  が共に水素原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシカルボニル基ではない。）を表し、ZはO又はSを表す。〕で表される化合物とを反応させることを特徴とする、式〔1〕



(式中、A、Q、X、Z、R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は前記と同一の意味を表す。)

で表される化合物の製造方法。

#### 5. 一般式 [1]



〔式中、AはN又はCR<sub>3</sub>を表し、ZはO又はSを表し、Qは炭素原子でベンゼン環と結合している、N、O、もしくはSを同一または相異なって1～4個含む置換基を有していてもよい5～6員のヘテロ環を表し、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>は各々独立して水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1-6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、ハロゲン原子又はシアノ基を表し、R<sub>3</sub>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、ホルミル基、アシル基を表すか、又はR<sub>2</sub>と一緒に環を形成していても良く、Xは、式NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub> (式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は各々独立して、水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、ヒドロキシルC<sub>2-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、アミノC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されてもよいヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、

又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表すか、 $R_4$  と  $R_5$  が一緒になってヘテロ環を形成してもよい。但し、 $R_4$  と  $R_5$  が共に水素原子、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、水酸基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、ハロ  $C_{1-6}$  アルコキシ基又はアシルオキシ基ではない。)を表す。)で表される化合物又はその農園芸学上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP96/01155

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl<sup>6</sup> C07D413/12, 413/14, 417/14, A61K43/76, 43/84, 47/10, 47/30

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl<sup>6</sup> C07D413/12, 413/14, 417/14, A61K43/76, 43/84, 47/10, 47/30

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO, 96/4278, A1 (Nippon Soda Co., Ltd.), February 15, 1996 (15. 02. 96), Full descriptions & AU, 9530871, A	1 - 5
X	JP, 5-202038, A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), August 10, 1993 (10. 08. 93), Full descriptions (Family: none)	1 - 5
A	WO, 94/17059, A1 (Nippon Soda Co., Ltd.), August 4, 1994 (04. 08. 94), Full descriptions & AU, 9458914, A & JP, 6-516872, A	1 - 5
A	JP, 4-342586, A (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), November 30, 1992 (30. 11. 92), Full descriptions (Family: none)	1 - 5

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"A" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

August 6, 1996 (06. 08. 96)

Date of mailing of the international search report

August 20, 1996 (20. 08. 96)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>8</sup> C 07 D 413/12, 413/14, 417/14  
A 61 K 43/76, 43/84, 47/10, 47/30

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>8</sup> C 07 D 413/12, 413/14, 417/14  
A 61 K 43/76, 43/84, 47/10, 47/30

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)  
CAS ONLINE

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
P, X	WO, 96/4278, A1 (日本曹達株式会社), 15. 2月. 199 (15. 02. 96), 全文&AU, 9530871, A	1-5
X	J P, 5-202038, A (住友化学工業株式会社), 10. 8月. 1993 (10. 08. 93), 全文 (ファミリーなし)	1-5
A	WO, 94/17059, A1 (日本曹達株式会社), 4. 8月. 199 (04. 08. 94), 全文&AU, 9458914, A& J P, 6-516872, A	1-5
A	J P, 4-342586, A (石原産業株式会社), 30. 11月. 19 (30. 11. 92), 全文 (ファミリーなし)	1-5

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 06. 08. 96

国際調査報告の発送日

20.08.96

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

4C

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3454